

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001 年 12 月 13 日 (13.12.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/94309 A1

(51) 国際特許分類: C07D 207/32, 207/327, 209/08, 277/46, 277/50, 333/40, 213/75, 405/04, 405/12, 277/46, 333/34, 409/06, 409/14

(74) 代理人: 山内秀晃, 外 (YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒553-0002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/04430

(22) 国際出願日: 2001 年 5 月 28 日 (28.05.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2000-166305 2000 年 6 月 2 日 (02.06.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

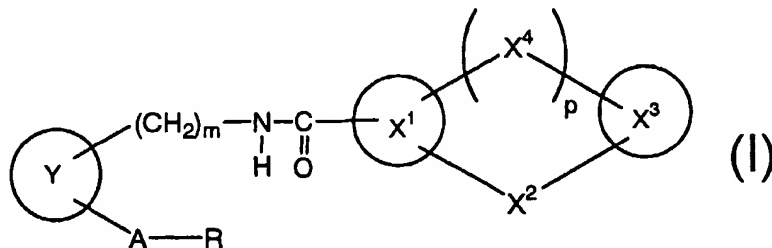
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 谷本憲彦 (TANIMOTO, Norihiko) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 有村昭典 (ARIMURA, Akinori) [JP/JP]; 〒561-0825 大阪府豊中市二葉町3丁目1番1号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DRUG COMPOSITION ANTAGONISTIC TO BOTH PGD₂/TXA₂ RECEPTORS

(54) 発明の名称: PGD₂/TXA₂両受容体拮抗性医薬組成物



(57) Abstract: A compound which has an antagonistic effect on both thromboxane A₂ and prostaglandin D₂ receptors. The compound is represented by the formula (I), wherein A is alkylene optionally having an unsaturated bond; R is -C(=O)-R¹, etc. (R¹ is hydroxy, etc.); m is 0 or 1; p is 0 or 1; X¹ and X³ each independently is optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, etc.; X² is a single bond, -CH₂-, -S-, -SO₂-, -CH₂-O-, -O-CH₂-, -CH₂-S-, -S-CH₂-, etc.; and X⁴ is -CH₂-, -CH₂-CH₂-, -C(=O)-, etc.

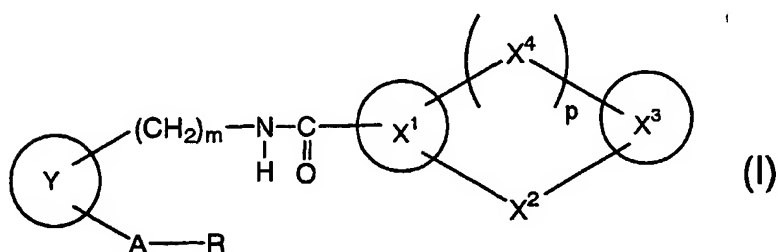
[続葉有]

WO 01/94309 A1



(57) 要約:

トロンボキサン A₂ および プロスタグランジン D₂ の両受容体拮抗作用を有する化合物として、式 (I) :



(式中、Aは不飽和結合を有していてもよいアルキレン；Rは $-C(=O)-R^1$ など； R^1 はヒドロキシなど；mは0または1；pは0または1； X^1 および X^3 はそれぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールなど； X^2 は単結合、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ など； X^4 は $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ などである。)で示される化合物を見出した。

明細書

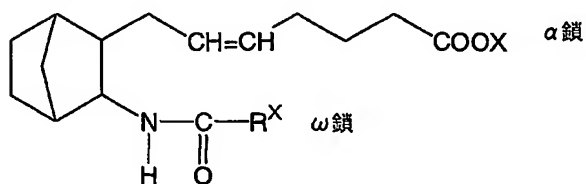
PGD₂/TXA₂両受容体拮抗性医薬組成物

5 技術分野

本発明は、PGD₂/TXA₂両受容体拮抗性医薬組成物、詳しくは〔2.2.1〕および〔3.1.1〕ビシクロ骨格を有する化合物に関する。

背景技術

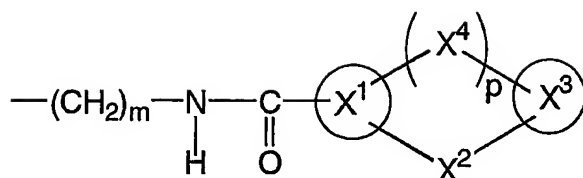
10 PGD₂/TXA₂両受容体拮抗性医薬組成物としては、WO99/15502に、式：



(式中、R^Xは置換されていてもよい単環または縮合ヘテロ環であり、Xは水素またはアルキルである。)で示される化合物が記載されている。上記化合物は、α鎖として、式：-CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-CH₂-COOX (Xは水素またはアルキル)で示される基を有し、ω鎖上のRが、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシなどで置換されていてもよい単環または縮合ヘテロ環である化合物である。

また、本発明に係る〔2.2.1〕および〔3.1.1〕ビシクロ骨格を有する化合物に類似する化合物は、WO97/00853公報に開示されている。この公報では、化合物の用途としてプロスタグランジンD₂ (PGD₂)受容体拮抗剤が記載されている。

しかし、これらの公報には、ビシクロ環のω鎖として、式：



(式中、 X^1 および X^3 はそれぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基； X^2 は単結合、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ など； X^4 は $-CH_2-$ など；
 5 m は0または1； p は0または1)で示される基を有し、かつピシクロ環の α 鎖として、式： $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-COOR^2$ (R^2 は水素またはアルキル)で示される基以外の基を有する化合物は、ほとんど記載されていない。

10 TXA_2 受容体拮抗剤と PGD_2 受容体拮抗剤とはその作用点、作用機序が異なると共にその適用も異なり、全く異なる性質を有している。

他方、 TXA_2 受容体拮抗作用と PGD_2 受容体拮抗作用の両者を併せ持つ化合物があれば、 TXA_2 あるいは PGD_2 に起因するあらゆる疾患に対して有効な治療剤となり得る。

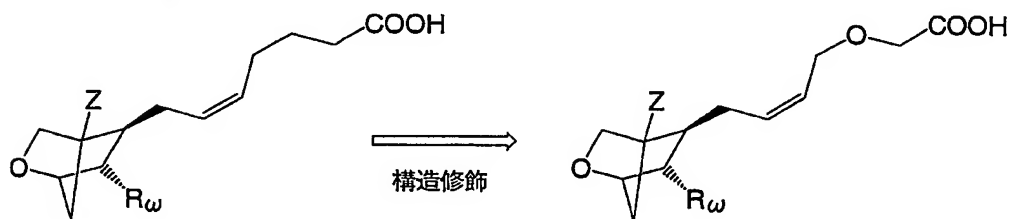
15 例えば、気管支喘息においては、 TXA_2 は強力な気管支収縮および気道過敏性亢進作用を示し、 PGD_2 は炎症性細胞の浸潤作用を示すことが判明している。これらのことから、 TXA_2 および PGD_2 は喘息の発症および病態進展の原因物質であると考えられており、両者に対して拮抗作用を有する化合物は従来の各々の受容体拮抗物質と比較して、より強力な抗喘息治療剤として有用となる可能性が
 20 考えられる。

また、アレルギー性鼻炎においては、 TXA_2 や PGD_2 は血管透過性亢進作用により鼻粘膜の浮腫を引き起こし、さらに PGD_2 は血管の拡張作用により鼻閉を誘導すると考えられている。従って、両者に対して拮抗作用を有する化合物は従来の各々の受容体拮抗物質と比較して、より強力な鼻閉治療剤として有用となる
 25 可能性が考えられる。

また、 TXA_2 受容体拮抗剤と PGD_2 受容体拮抗剤の同時投与（併用療法、合剤等）によって、これらの症状や疾患を治療することも考えられるが、複数の薬剤を用いるには、代謝速度の違いから生じる問題点等を考慮する必要がある。例えば、最大血中濃度を示す時間や薬効持続時間等が異なれば、必ずしも両受容体拮抗作用がバランスよく同じ時期に発現するとは限らず、期待する相加または相乗効果が得られない可能性がある。

従って、 TXA_2/PGD_2 両受容体拮抗作用を有する医薬品の開発が期待されており、両受容体拮抗作用を併せ持つ化合物の適用範囲は非常に広いものとなり、従来では認められていない新たに優れた効果が期待される。

一方、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, Vol.2, No.9, pp.1069-1072, 1992 には、代謝的に安定な TXA_2/PGH_2 受容体拮抗剤として、3-オキサ誘導体を合成した旨が記載されているが、該文献には化合物の活性値が記載されているにすぎず、代謝的に安定か否かは記載されていない。



（式中、Zは p-フルオロフェニル； R_{ω} はベンゼンスルホンアミノなど）

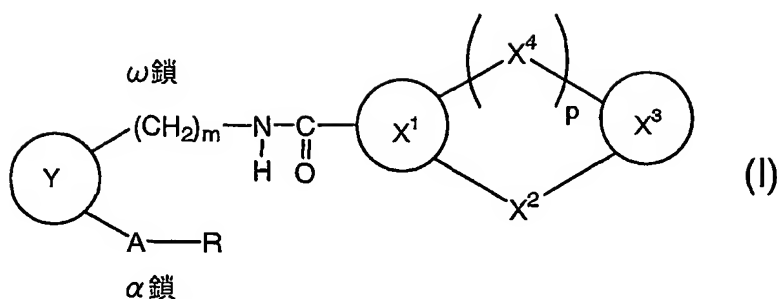
また、PROSTAGLANDINS, 1986, 31, 95 には、 PGI_2 ミメティックスである ILOPROST を 3-オキサ誘導体とすることで代謝的に安定となる旨記載されている。しかし、ラットの代謝酵素存在下での各化合物の残存活性を比較しているに過ぎず、活性代謝物が生成している可能性もあり、代謝的に安定か否かは記載されていない。

発明の開示

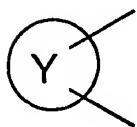
本発明者らは、 TXA_2/PGD_2 両受容体拮抗作用を有する医薬組成物を開発するために鋭意研究し、新規な化合物およびその医薬組成物を見出した。

即ち、本発明は、

(1) 式 (I) :

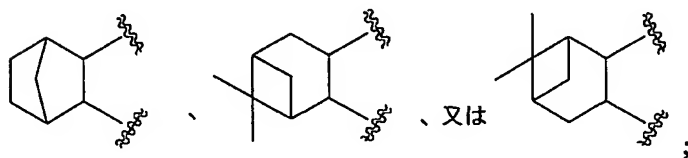


(式中、



5

は、



Aはヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン；

10

Rは $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリル；

R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノ；

mは0または1；

但し、mが1であり、Aが $-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつ

15

Rが $-C(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合、

およびAが $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつRが $-C$

$(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合を除く；

pは0または1 (p=0ときは、 X^1 と X^3 は X^4 を介して結合していない)；

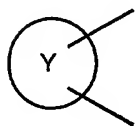
X^1 および X^3 はそれぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されてい

てもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基；

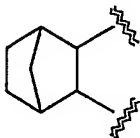
X^2 は単結合、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、
 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3)$
 5 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})$
 $-\text{CH}_2-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}$
 $\text{H}_2-\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SO}_2$
 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}_2)-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{Me})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})-$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$
 $\text{NH}-$ または $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{Me})-$ ；

10 X^4 は $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、
 $-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-$ 、
 $-\text{SO}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}-$ 、または $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ で
ある。

15 但し、

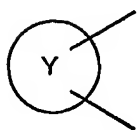


が、

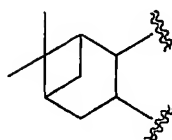


であり、

20 Aが $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、Rが $-\text{COOH}$ であり、m
が1であり、pが0であり、 X^1 および X^3 がフェニルであり、かつ X^2 が $-\text{N}=\text{N}-$
である場合を除き、



が、



であり、

- 5 X^1 および X^3 がフェニルであり、 X^2 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{O}-$ 、または $-\text{S}-$ であり、 m が 0 であり、かつ p が 0 であるときは、
 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、
 A が $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、
 10 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、および
 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{CH}_2\text{OH}$ である場合を除く。)
 15 で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

- (2) A がヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレンであり、 R が $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^1$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^1$ 、またはテトラゾ
 20 リルであり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノである (但し、 A が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、かつ R が $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ) である場合、および A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、かつ R が $-\text{C}$

(=O) - R¹ (R¹はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合を除く)である上記(1)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(3) Aがヘテロ原子が介在している、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレンである上記(1)または(2)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(4) Aがヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよい炭素数1～4または7～9のアルキレンである上記(1)または(2)記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(5) Aが -CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH(F)-, -CH₂-CH=CH-, -CH₂-O-CH₂-, -CH₂-CH=C(F)-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH=CH-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH=CH-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-O-CH₂-, -CH₂-CH₂-S-CH₂-, -CH₂-CO-NH-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH₂-CH₂-CH₂-O-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-S-CH₂-, -CH₂-CH₂-CO-NH-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-C(CH₃)₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH(F)-, -CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-, -CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-C(CH₃)₂-, -CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-CH(F)-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH=C(CH₃)-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-C(CH₃)=CH-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH=C(F)-, -CH₂-CH₂-

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-\text{CH}_2-$
 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-$
5 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$
 CH_2-CH_2- 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、または
10 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ である上記 (1) または (2) 記載の化合物、そのプロドラッグ、
その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(6) Aが $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-$
 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$
15 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ である上記 (5) 記載
の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和
物、

(7) Aが $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ である上記 (6)
記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶
20 媒和物、

(8) X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアリールまた
は置換されていてもよいヘテロアリールである上記 (1) ~ (7) のいずれかに
記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶
媒和物、

25 (9) X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいヘテロアリール
である上記 (8) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、
またはそれらの溶媒和物、

(10) X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいヘテロアールである上記 (9) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

5 (11) X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいチエニルまたは置換されていてもよいベンゾチエニルである上記 (9) 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(12) X^2 が単結合、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、または $-NH-C(=O)-NH-$ である上記 (1) ~ (11) のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、
10 その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(13) m が 0 であり、 p が 0 である上記 (1) ~ (12) のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(14) R が $-C(=O)-R^1$ であり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、
15 または置換されていてもよいアミノである上記 (1) ~ (13) のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物、

(15) 上記 (1) ~ (14) のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物を含有することを特徴とする医薬組成物、
20

(16) PGD_2/TXA_2 両受容体拮抗性である上記 (15) 記載の医薬組成物、

(17) 喘息治療用である上記 (15) 記載の医薬組成物、

(18) 鼻閉治療用である上記 (15) 記載の医薬組成物、

25 (19) アレルギー性結膜炎治療用である上記 (15) 記載の医薬組成物、

(20) アレルギー性鼻炎治療用である上記 (15) 記載の医薬組成物、

(21) 喘息、鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎治療用

薬剤を製造するための上記（１）～（１４）のいずれかに記載の化合物の使用、

（２２）上記（１）～（１４）のいずれかに記載の化合物を投与する鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎の治療方法、

- （２３） 式： $X^3-X^2-X^1-COOH$ （式中、 X^3 はアルキル、アルキル
 5 オキシまたはハロゲンで置換されていてもよいピロリル、アルキル、アルキルオ
 キシまたはハロゲンで置換されていてもよいインドリル、アルキル、アルキルオ
 キシまたはハロゲンで置換されていてもよいインドリニルまたはアルキル、アル
 キルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよい１，２，３，４－テトラヒド
 ロキノリル、 X^2 は $-SO_2-$ 、 $-S-$ または $-CH_2-$ 、 X^1 はチエニルである）
 10 で示される化合物またはその塩、

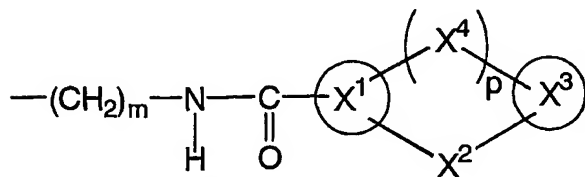
- （２４） 式： $-X^1-X^2-X^3$ で示される基が、５－（１－ピロリルスル
 ホニル）チオフェン－２－イル、５－〔（２－メチル－１－ピロリル）スルホニ
 ル〕チオフェン－２－イルまたは５－〔（２，５－ジメチル－１－ピロリル）ス
 ルホニル〕チオフェン－２－イルである上記（２３）記載の化合物またはその塩、
 15 に関する。

発明を実施するための最良の形態

本発明に含まれる化合物の特徴は、

- （Ａ）ビシクロ環（上記式（Ｉ）中、Ｙ環を意味する。）が〔２．２．１〕また
 20 は〔３．１．１〕骨格であること、

（Ｂ）ビシクロ環に結合しているω鎖（上記式（Ｉ）中、式：



- で示される基を意味する。）に $-NH-CO-$ 構造を含むこと、 X^1 および X^3 が
 それぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロ
 25 アリールまたは置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基であること、

(C) X^1 と X^3 が X^2 を介して結合していること

(D) α 鎖が式： $-A-R$ （式中、 A はヘテロ原子が介在していてもよく、オキソ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン； R は式： $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2$
5 $-R^1$ 、またはテトラゾリル； R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノ）で示される基であること等が挙げられる。

また、 A が $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつ R が $-C(=O)-R^1$ （ R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ）である場合、 α 鎖が
10 β 酸化を受け、代謝的に不安定であるため、本発明化合物には、 A が $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつ R が $-C(=O)-R^1$ （ R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ）である化合物は含まれない。

すなわち、本発明化合物は、 A 及び R に特徴を有し、代謝的に改善された化合物であり、上記の（A）～（D）を具備することにより、 PGD_2/TXA_2 両受容体拮抗性を有する化合物である。

15

本発明の好ましい態様は、式（I）で示される化合物において、

（1） X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールである場合、

（2） X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいヘテロアリールで
20 ある場合、

（3） X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいヘテロアリールである場合、

（4） X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいチエニルまたは置換されていてもよいベンゾチエニルである場合、

（5） X^2 が単結合、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、または $-NH-C(=O)-NH-$ で
25 ある場合、

- (6) mが0であり、pが0である場合、
- (7) Rが $-C(=O)-R^1$ であり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノである場合、
- (8) (1)～(4)のいずれかと(5)の組合わせである場合、
- 5 (9) (1)～(4)のいずれかと(6)の組合わせである場合、
- (10) (1)～(4)のいずれかと(7)の組合わせである場合等である。

本明細書において用いる各種語句の定義は、以下の通りである。

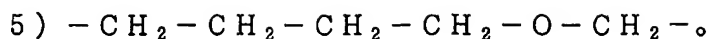
- 「アルキレン」とは、C1～C9の直鎖状又は分枝状のアルキレンを意味し、
- 10 例えば、メチレン、メチルメチレン、ジメチルメチレン、エチルメチルメチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレンまたはノナメチレン等が挙げられる。上記アルキレンは、ヘテロ原子（酸素原子、硫黄原子または窒素原子等）を介在していてもよく、オキシ基(=O)を有してもよく、ハロゲン（例えば、F、Cl、Br、
- 15 I、好ましくはF）で置換されていてもよく、および／または不飽和結合（二重結合または三重結合）を鎖上に1個又はそれ以上、任意の位置に含んでいてもよい。例えば、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH(F)-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=C(F)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-CO-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、
- 20 $-CH_2-CH_2-CO-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(Me)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-C(Me)_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$
- 25

$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{F})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{Me})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$
 $\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Me})_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{F})$
 $-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$
5 $-\text{CH}_2-\text{C}=\text{C}(\text{Me})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Me})=\text{C}$
 $\text{H}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
 $\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-\text{CH}_2-$
 $\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
10 $\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-\text{CH}_2$
 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}$
 $\text{H}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
15 CH_2-CH_2- 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$
 $-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{C}$
 $\text{H}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ などが挙げられる。

上記「アルキレン」は、特に以下の態様が好ましい。

- 20 1) ヘテロ原子が介在している、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン、
- 2) ヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよい炭素数 1～4 または 7～9 のアルキレン、
- 25 3) $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{F})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{C}$
 $\text{H}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{C}$
 $\text{H}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}$

- $=CH-$ 、 $-CH=CH-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-CO-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CO-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(Me)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-C(Me)_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH(F)-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-C(Me)_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH(F)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-C(Me)_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH(F)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=C(Me)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-C(Me)=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=C(F)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=C(F)-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CO-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH=N-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-S-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、
 4) $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-O-CH_2-$ 、または
 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-S-CH_2-$ 、



「ヘテロアリアル」とは、酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を環内に1個以上含む5～7員の芳香族ヘテロ環、またはそれらが1個以上の芳香族炭素環もしくは他の芳香族ヘテロ環と縮合している芳香環から誘導される、置換可能な任意の位置に結合手を有する基を意味する。芳香族ヘテロ環または芳香族炭素環のいずれに結合手を有していてもよいし、芳香族ヘテロ環または芳香族炭素環を構成する炭素原子上のみならず、それらの環の窒素原子上に結合手を有していてもよい。例えば、ピロリル（例えば、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル）、ピリジル（例えば、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル）、ピラゾリル（例えば、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル）、イミダゾリル（例えば、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル）、ピリミジニル（例えば、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル）、ピラジニル（例えば、2-ピラジニル）、インドリル（例えば、1-インドリル、2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-インドリル、7-インドリル）、カルバゾリル（例えば、1-カルバゾリル、2-カルバゾリル、3-カルバゾリル、4-カルバゾリル、9-カルバゾリル）、ベンゾイミダゾリル（例えば、1-ベンゾイミダゾリル、2-ベンゾイミダゾリル、4-ベンゾイミダゾリル、5-ベンゾイミダゾリル）、インダゾリル（例えば、1-インダゾリル、2-インダゾリル、3-インダゾリル、4-インダゾリル、5-インダゾリル、6-インダゾリル、7-インダゾリル）、キノリル（例えば、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル）、イソキノリル（例えば、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル）、フリル（例えば、2-フリル、3-フリル）、ベンゾフリル（例えば、2-ベンゾフリル、3-ベンゾフリル、4-ベンゾフリル、5-ベンゾフリル、6-ベンゾフリル、7-ベンゾフリル）、チエニル（例

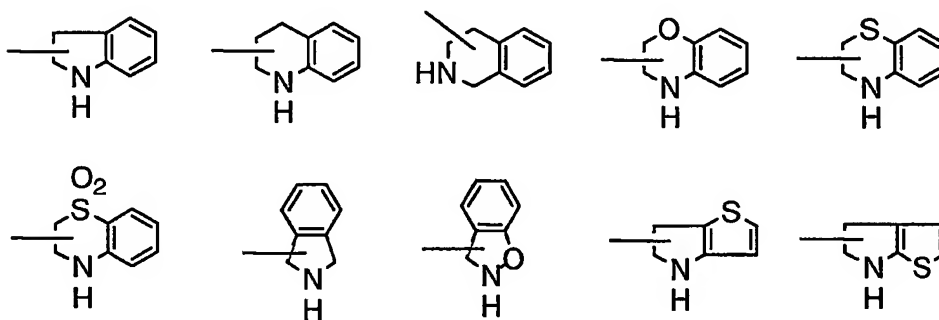
例えば、2-チエニル、3-チエニル)、ベンゾチエニル(例えば、ベンゾ [b] チ
オフェン-2-イル、ベンゾ [b] チオフェン-3-イル、ベンゾ [b] チオフェ
ン-4-イル、ベンゾ [b] チオフェン-5-イル、ベンゾ [b] チオフェン-6
-イル、ベンゾ [b] チオフェン-7-イル、)、ジベンゾチエニル(例えば、2
5 -ジベンゾチエニル、3-ジベンゾチエニル)、ジベンゾフリル(例えば、2-
ジベンゾフリル、3-ジベンゾフリル)、ナフトチエニル(例えば、ナフト [2,
3-b] チオフェン-2-イル、ナフト [2, 3-b] チオフェン-3-イル、ナフト
[1, 2-b] チオフェン-2-イル、ナフト [1, 2-b] チオフェン-3-イル)、
オキサゾリル(例えば、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリ
10 ル)、イソキサゾリル(例えば、3-イソキサゾリル、4-イソキサゾリル、5
-イソキサゾリル)、チアゾリル(例えば、2-チアゾリル、4-チアゾリル、
5-チアゾリル)、イソチアゾリル(例えば、3-イソチアゾリル、4-イソチ
アゾリル、5-イソチアゾリル)、イミダゾチアゾリル(例えば、イミダゾ [2,
1-b] チアゾール-2-イル、イミダゾ [2, 1-b] チアゾール-3-イル)、
15 ベンゾイソキサゾリル(例えば、ベンゾ [d] イソキサゾール-3-イル)、ベ
ンゾチアゾリル(例えば、ベンゾ [d] チアゾール-2-イル)等が挙げられる。

上記「ヘテロアリール」に縮合していてもよい「芳香族炭素環もしくは他の芳
香族ヘテロ環」とは、酸素原子、硫黄原子および／または窒素原子を環内に 1 個
20 以上含んでいてもよい 5～7 員の芳香環、またはそれらが 2 以上縮合している芳
香環を意味する。

「アリール」とは、単環芳香族炭素環式基(例えば、フェニル)または縮合芳
香族炭素環式基(例えば、1-ナフチル、2-ナフチル、1-アントリル、9-
アントリル、1-フェナントリル、10-フェナントリル等)を意味する。

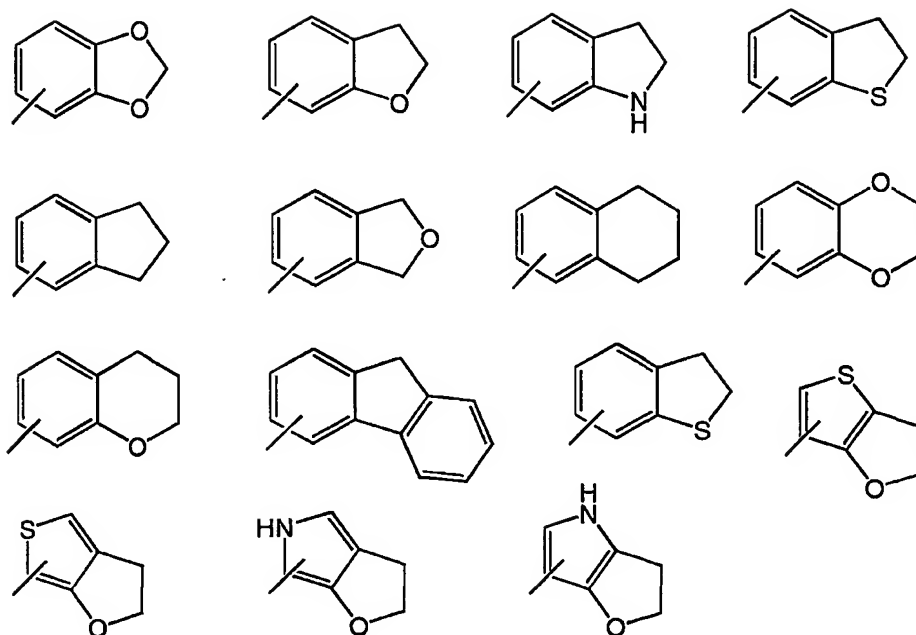
25 「非芳香族ヘテロ環式基」とは、酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原
子を環内に 1 個以上含む 3～7 員の非芳香族ヘテロ環、またはそれらが 1 個以上
の炭素環(例えば、芳香族炭素環)もしくは他のヘテロ環(例えば、芳香族ヘテ

口環）と縮合している非芳香族ヘテロ環から誘導される、置換可能な任意の位置
 に結合手を有する基を意味する。非芳香族ヘテロ環式基を構成する炭素原子上の
 みならず、それらの環の窒素原子上に結合手を有していてもよい。例えば、アジ
 リジニル、ピペリジノ、ピペリジニル、モルホリノ、モルホリニル、ピロリニル、
 5 ピロリジニル、イミダゾリニル、ピペラジノ、ピペラジニル、イソオキサゾリニ
 ル、チオラニル、テトラヒドロフラニル、ジオキサニル、オキサチアニル、テト
 ラヒドロピラニル等が挙げられる。好ましくは、5員又は6員の含窒素非芳香族
 ヘテロ環式基が挙げられる。1個以上の炭素環（例えば、芳香族炭素環）もしくは
 は他のヘテロ環（例えば、芳香族ヘテロ環）と縮合している非芳香族ヘテロ環か
 10 ら誘導される、置換可能な任意の位置に結合手を有する基としては、以下の基等
 が挙げられる。



（なお、炭素原子または窒素原子上の任意の位置に結合手を有していてもよい。）

なお、「アリール」、「ヘテロアリール」は、4員～7員のシクロアルカン、
 15 または4員～7員の非芳香族ヘテロ環が縮合していてもよい。シクロアルカンと
 しては、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタンが挙
 げられる。非芳香族ヘテロ環としては、ピロリジン、ピペラジン、オキサラン、
 1,3-ジオキサラン、1,4-ジオキサラン、チオラン等が挙げられる。これら
 シクロアルカンおよび非芳香族ヘテロ環には、さらに芳香族炭素環または芳香族
 20 ヘテロ環が縮合していてもよい。4員～7員のシクロアルカンまたは4員～7員
 の非芳香族ヘテロ環が縮合しているアリールまたはヘテロアリールとしては、例
 えば、以下の基が挙げられる。



- 「置換されていてもよいアリール」、「置換されていてもよいヘテロアリール」、
 「置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基」における置換基としては、式：
- 5 $-Z^1-Z^2$ (式中、 Z^1 は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-NH-C(=O)-$ 、 $-NH-C(=O)-O-$ 、 $-NH-SO_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、または $-SO_2-$ であり、 Z^2 はアルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルキルまたはハロゲンで置換されていてもよいアリール、アルキルまたはハロゲンで置換されていてもよいヘテロアリール、アルキルまたはハロゲンで置換されていてもよいアリールアルキル、アルキルまたはハロゲンで置換されていてもよいヘテロアリールアルキルである)
- 10 示される基、カルボキシ、ハロゲン (F、Cl、Br、I)、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、メルカプト、チオホルミル、チオアセチル、チオカルボキシ、ジチオカルボキシ、チオカルバモイル、スルフィノ、スルフォ、スルファモイル、スルホアミノ、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアミノアルキル、ヒドロキシアミノ、カルバモイル、ヒドラジノから選ば
- 15 れる基などが挙げられる。それらの置換基は、上記アリール、ヘテロアリール、

非芳香族ヘテロ環式基の環上の置換可能な任意の 1 ～ 3 個の位置にて置換することができる。

5 「アルキル」とは、直鎖状もしくは分枝鎖状の C 1 ～ C 8 のアルキルまたは C 3 ～ C 8 の環状アルキルを意味する。例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル等が挙げられる。

10 「ハロアルキル」とは、1 個またはそれ以上のハロゲンで置換された直鎖状もしくは分枝鎖状の C 1 ～ C 8 のハロアルキルまたは C 3 ～ C 8 の環状ハロアルキルを意味する。例えば、クロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、トリクロロメチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、1, 1-ジクロロエチル等が挙げられる。

15 「アルケニル」とは、1 個またはそれ以上の二重結合を有する、直鎖状もしくは分枝鎖状の C 2 ～ C 8 のアルケニルまたは C 3 ～ C 8 の環状アルケニルを意味する。例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、イソプロペニル、2-シクロブテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル等が挙げられる。

20

「アルキニル」とは、1 個またはそれ以上の三重結合を有する、直鎖状もしくは分枝鎖状の C 2 ～ C 8 のアルキニルを意味する。例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル等が挙げられる。

25

「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素、ヨ素を意味する。

「アリールアルキル」、「ヘテロアリールアルキル」中の「アルキル」は上記

「アルキル」と同意義であり、「アリール」は上記「アリール」と同意義であり、「ヘテロアリール」は上記「ヘテロアリール」と同意義である。

「ヒドロキシアルキル」とは、1～2個のヒドロキシで置換された上記「アルキル」を意味する。例えば、ヒドロキシメチル、1-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエチル、1, 2-ジヒドロキシエチル、1, 2-ジヒドロキシ-n-プロピル等を意味する。

「置換されていてもよいアミノ」、「置換されていてもよいアミノアルキル」の置換基としては、上記「アルキル」、上記「アリールアルキル」、上記「アリール」、上記「ヘテロアリール」、上記「ヘテロアリールアルキル」、ヒドロキシ、アルキルスルホニル等が挙げられる。これらの置換基でモノ置換またはジ置換されていてもよい。また、「アルキル」が置換している場合は、アミノ基の窒素原子と一緒に環を形成していてもよい。

15

「置換されていてもよいアミノ」としては、例えば、アミノ、N,N-ジメチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、N,N-ジエチルアミノ、ピロリジノ、ピペリジノ、N-メチル-N-フェニルアミノ、イソプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ヒドロキシアミノ、アルキルスルホニルアミノ（例えば、メタンスルホニルアミノ、エタンスルホニルアミノなど）、アリールスルホニル（例えば、ベンゼンスルホニルアミノ、トルエンスルホニルアミノなど）、N-アルキル-N-アルキルスルホニルアミノ（例えば、N-メチル-N-メタンスルホニルアミノなど）、ハロゲン化アルキルスルホニルアミノ（例えば、トリフルオロメタンスルホニルアミノなど）等が挙げられる。

「置換されていてもよいアミノアルキル」としては、例えば、N,N-ジメチルアミノメチル、N-エチル-N-メチルアミノメチル、N,N-ジエチルアミノメチル、ピロリジノメチル、ピペリジノメチル、N-メチル-N-フェニルアミノメチル、イソブ

ロピルアミノメチル、N,N-ジイソプロピルアミノメチル等が挙げられる。

「PGD₂/TXA₂両受容体拮抗性医薬組成物」とは、PGD₂受容体拮抗作用およびTXA₂受容体拮抗作用を有する式(I)で示される化合物を少なくとも1つ含有する医薬組成物を意味する。式(I)で示される化合物以外に、他の活性成分（例えば、抗炎症剤、抗アレルギー剤など）、医薬品添加物（例えば、結合剤、賦形剤など）を含有していてもよい。

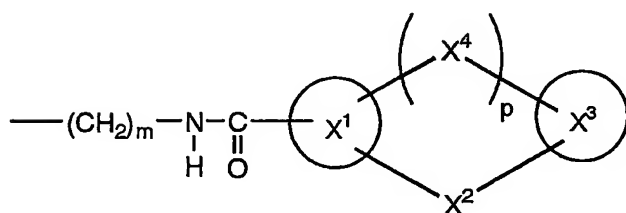
本発明化合物は、PGD₂受容体拮抗作用およびTXA₂受容体拮抗作用を有しており、生体内において、PGD₂受容体拮抗作用およびTXA₂受容体拮抗作用を発揮することができる化合物である。例えば、両受容体拮抗作用をインビトロで有していても、PGD₂受容体とTXA₂受容体に対する親和性が極端に異なる場合、生体内では、投与された化合物が、親和性の高い受容体に優先的に結合し、両方の受容体に対する拮抗作用を発揮することができない場合がある。従って、本発明化合物としては、PGD₂受容体拮抗作用およびTXA₂受容体拮抗作用を有し、TXA₂受容体に対する親和性とPGD₂受容体に対する親和性の比が100倍、好ましくは50倍、さらに好ましくは10倍程度である化合物が好ましい。TXA₂受容体に対する親和性とPGD₂受容体に対する親和性の比は、例えば、IC₅₀値等を使用して計算することができる。

また、本発明化合物としては、TXA₂ヒト血小板膜画分結合活性(IC₅₀値)が0.1 μM以下のものが好ましく、ヒト血小板を使ったPGD₂受容体拮抗活性(IC₅₀値)が、0.1 μM以下のものが好ましい。特に、TXA₂ヒト血小板膜画分結合活性(IC₅₀値)及びヒト血小板を使ったPGD₂受容体拮抗活性(IC₅₀値)が共に0.1 μM以下である化合物が好ましく、さらには、それらの比が100倍、好ましくは50倍、さらに好ましくは10倍程度である化合物が好ましい。

なお、本発明には、式（I）で示される化合物を投与する喘息、鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎の治療方法、喘息、鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎治療用薬剤を製造するための式（I）で示される化合物の使用も包含される。

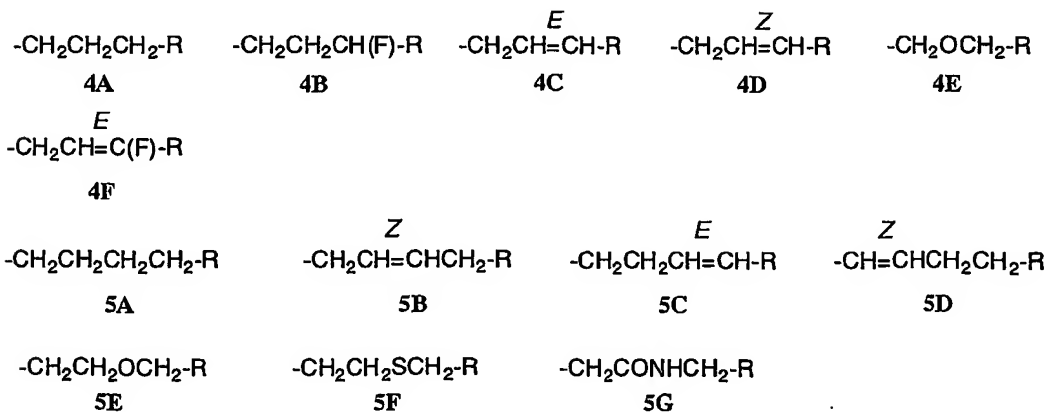
5

なお、式（I）で示される化合物において、 α 鎖は、式： $-A-R$ で示される基、 ω 鎖は、式：

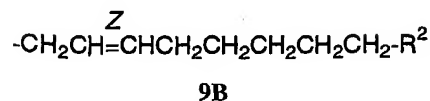
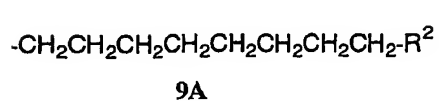
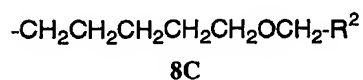
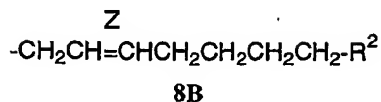
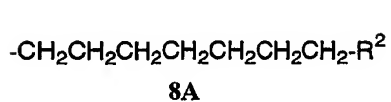
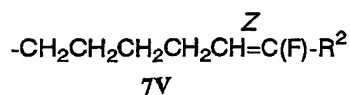
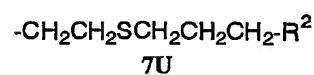
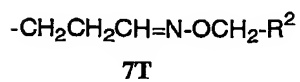
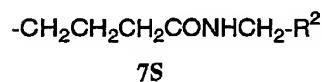
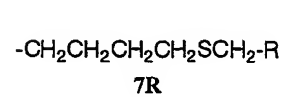
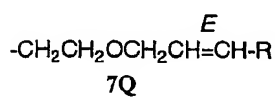
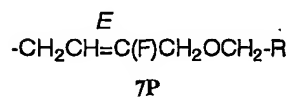
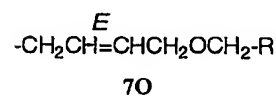
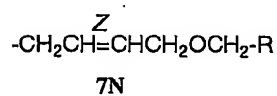
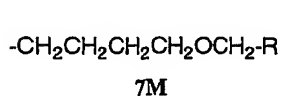
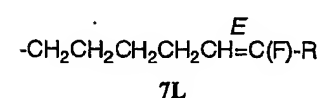
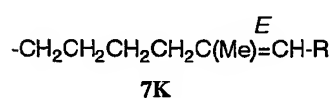
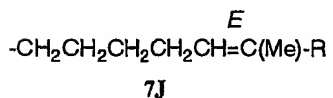
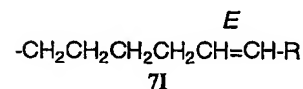
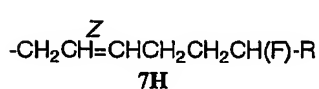
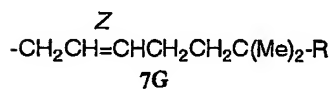
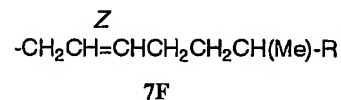
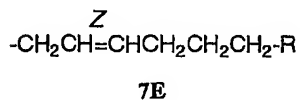
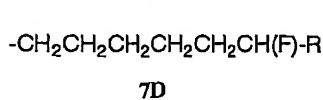
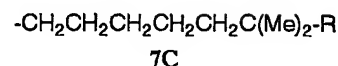
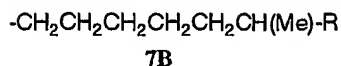
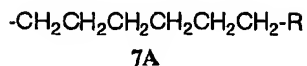
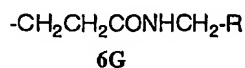
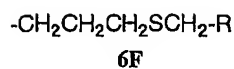
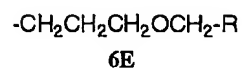
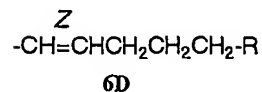
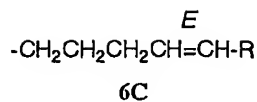
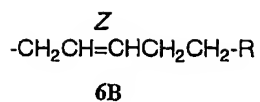
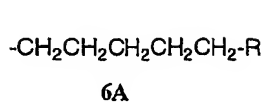


で示される基を意味する。

- 10 α 鎖としては、以下に示される基が好ましい。なお、EおよびZは各式中の二重結合におけるE体およびZ体を意味する。4A～9Bの各記号はそれぞれの式中のAに相当する部分を意味し、本明細書中の表1～表15でも共通の基を意味する。



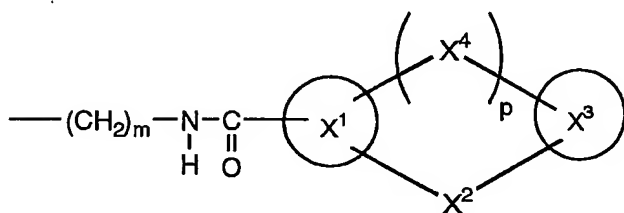
15



Rとしては、 $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリルが挙げられるが、特に好ましくは、 $-C(=O)-R^1$ であり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノである場合である。具体的には、
 5 Rとしては、 $COOH$ 、 $COOMe$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHSO_2Me$ 、 CH_2O
 H 、 CH_2OMe 、 $CONHMe$ 、 $CON(Me)SO_2Me$ 、5-テトラゾリル、
 $CONHSO_2Ph$ 、 $CONHSO_2CF_3$ などが挙げられる。

また、AとRの組合せについては、すべての組合せを包含するが、特に、表1～表15に記載されている組合せが好ましい。

10 ω 鎖としては、式：

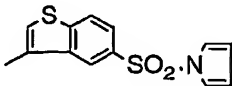
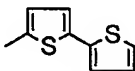
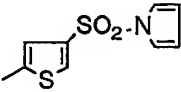
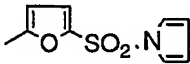
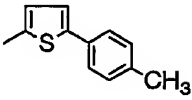
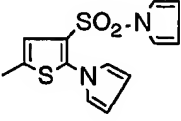
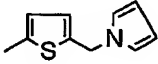
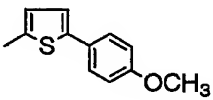
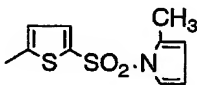
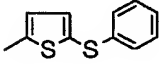
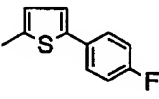
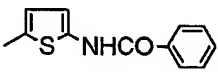
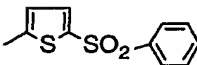
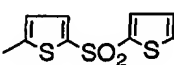

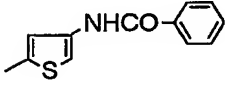
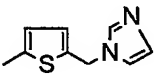
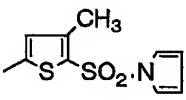
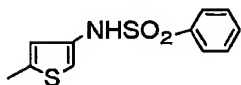
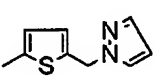
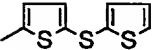
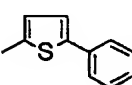
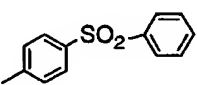
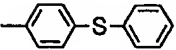
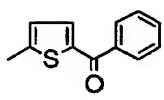
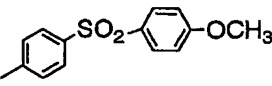
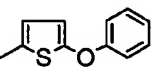
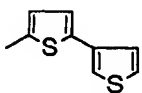
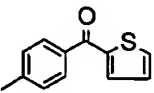
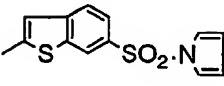


で示される基の中で、以下の態様が好ましい。

- 1) $m=0$ であり、 $p=0$ である場合、
- 2) X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアリールまたは置換
 15 されていてもよいヘテロアリールである場合、
- 3) X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいヘテロアリールである場合、
- 4) X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいヘテロアリールである場合、
- 20 5) X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいチエニルまたは置換されていてもよいベンゾチエニルである場合、
- 6) X^2 が単結合、 $-CH_2-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、または $-NH-C(=O)-NH-$ である場合。

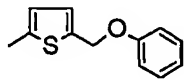
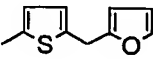
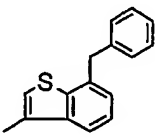
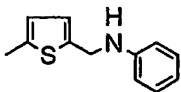
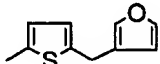
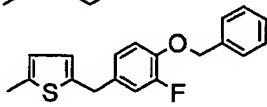
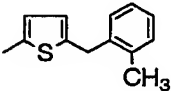
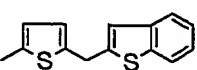
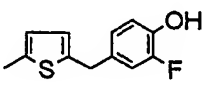
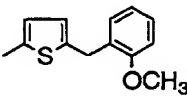
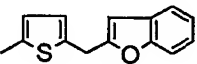
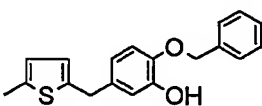
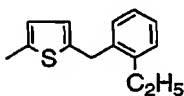
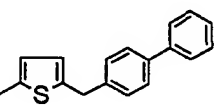
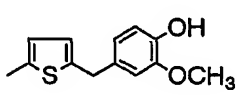
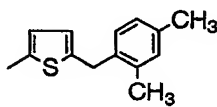
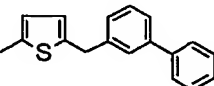
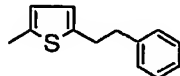
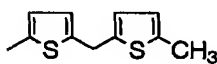
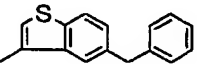
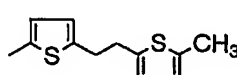
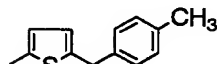
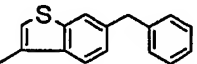
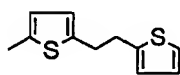
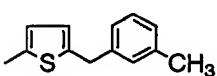
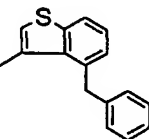
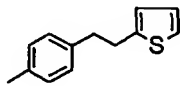
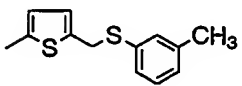
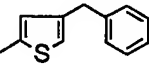
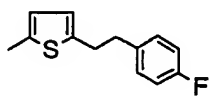
具体的には、式： $-X^1-X^2-X^3$ については、以下に記載されている組合せが好ましい。なお、以下の1～5 1 3の各記号はそれぞれ、式： $-X^1-X^2-X^3$ で示される基を意味し、本明細書中の表1～表1 5および参考例の化合物番号においても共通の基を意味する。

$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
1	12	23
2	13	24
3	14	25
4	15	26
5	16	27
6	17	28
7	18	29
8	19	30
9	20	31
10	21	32
11	22	

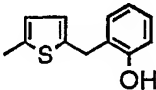
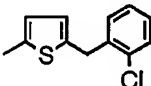
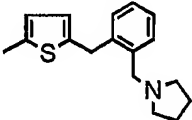
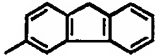
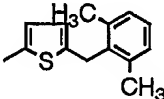
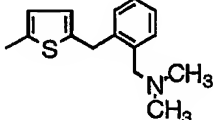
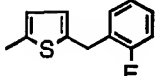
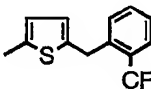
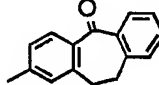
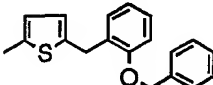
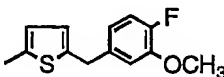
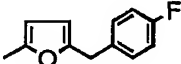
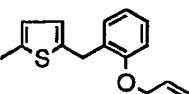
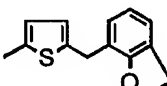
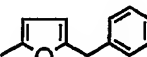
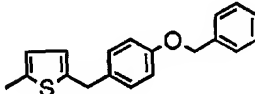
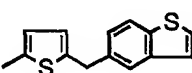
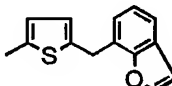
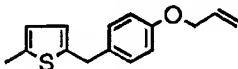
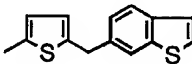
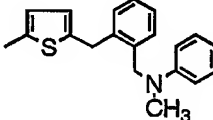
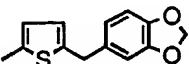
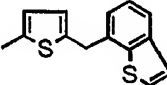
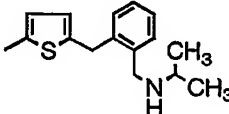
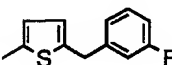
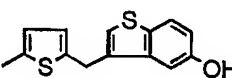
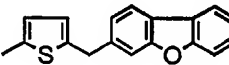
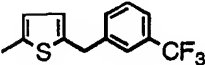
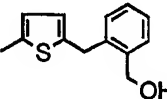
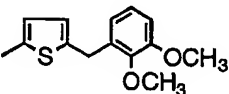
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
33 	43 	53 
34 	44 	54 
35 	45 	55 
36 	46 	56 
37 	47 	57 
38 	48 	58 
39 	49 	59 
40 	50 	60 
41 	51 	61 
42 	52 	62 

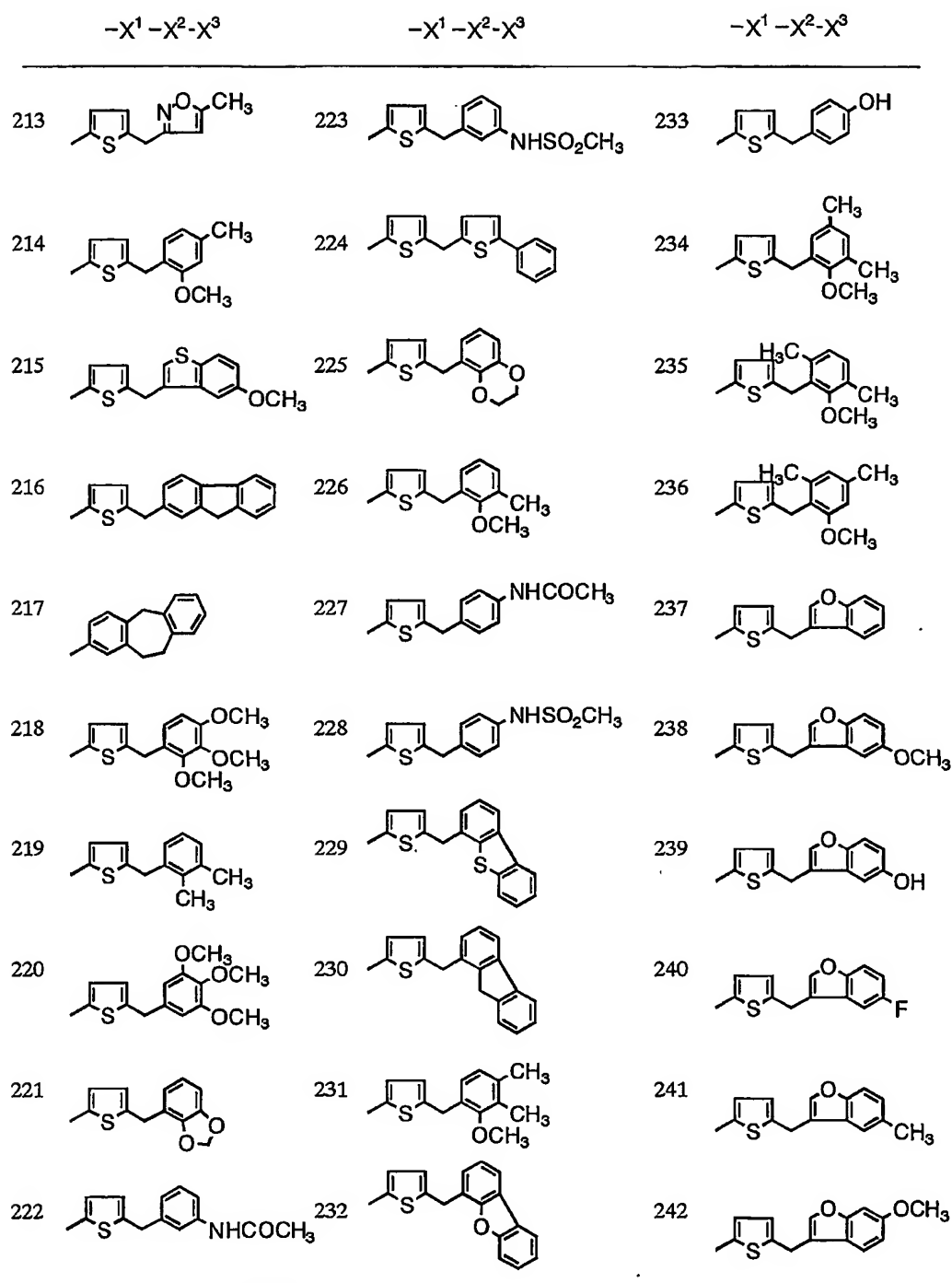
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
63	73	83
64	74	84
65	75	85
66	76	86
67	77	87
68	78	88
69	79	89
70	80	90
71	81	91
72	82	92

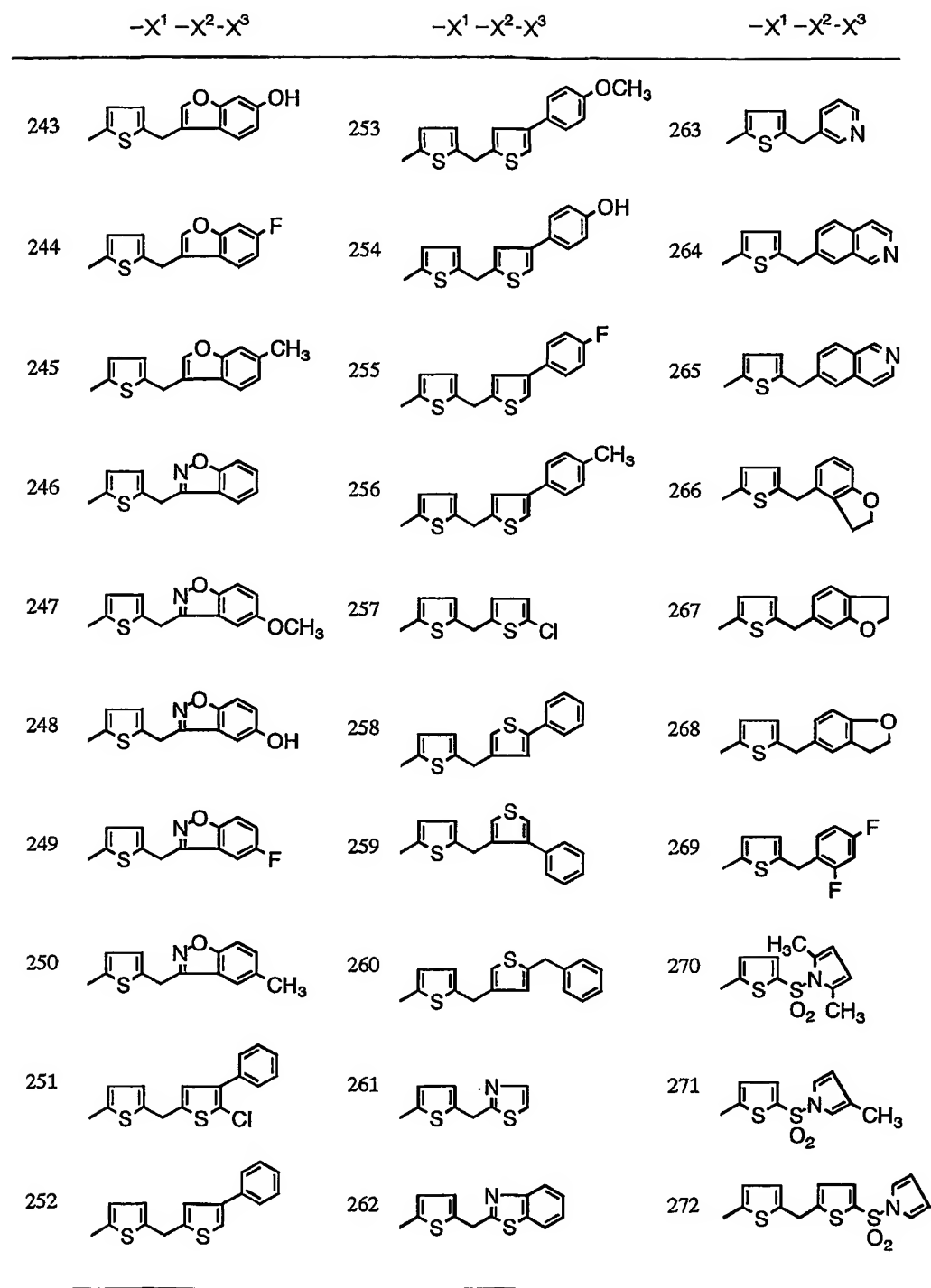
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
93	103	113
94	104	114
95	105	115
96	106	116
97	107	117
98	108	118
99	109	119
100	110	120
101	111	121
102	112	122

$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
123 	133 	143 
124 	134 	144 
125 	135 	145 
126 	136 	146 
127 	137 	147 
128 	138 	148 
129 	139 	149 
130 	140 	150 
131 	141 	151 
132 	142 	152 

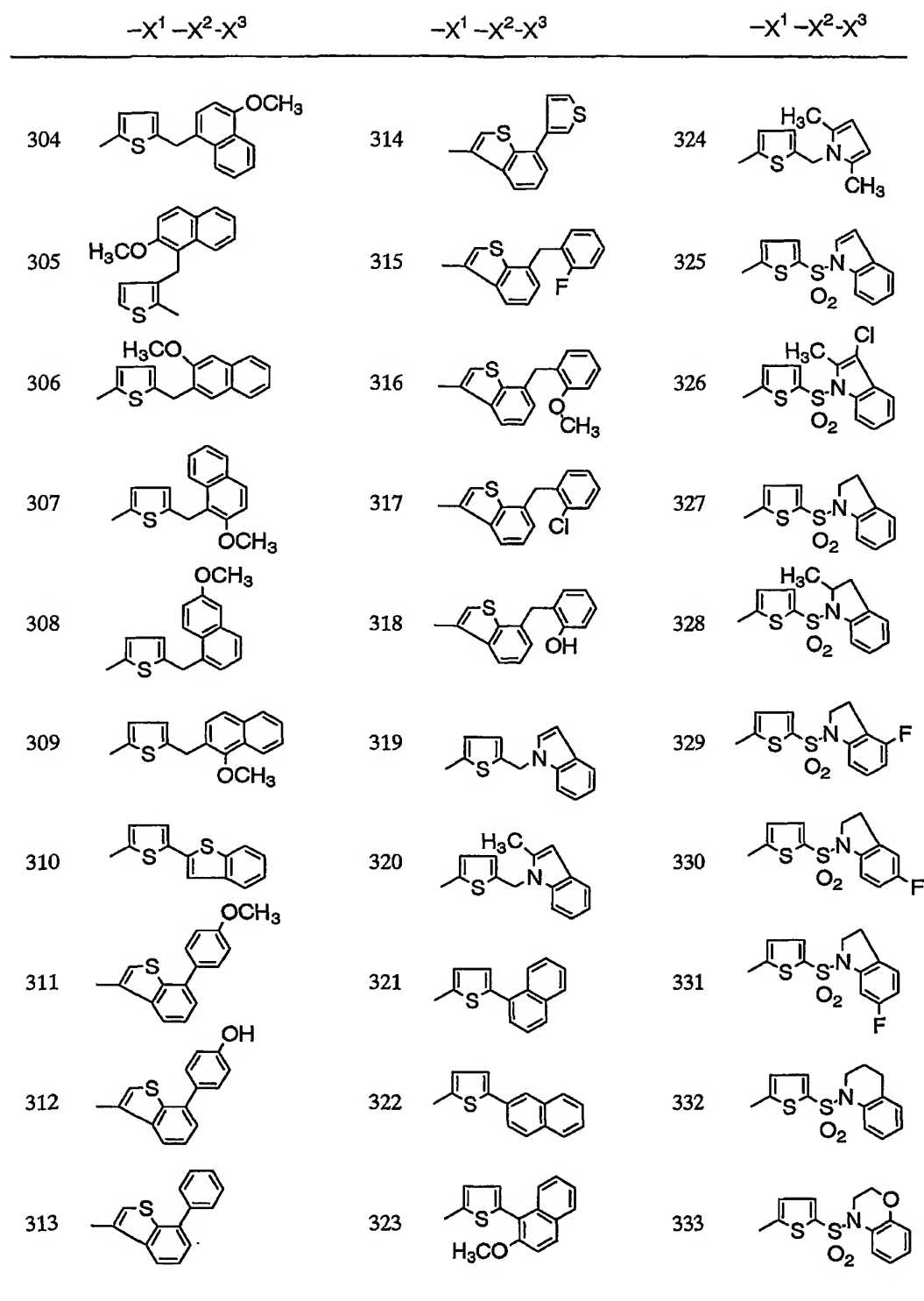
	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$		
153		163		173	
154		164		174	
155		165		175	
156		166		176	
157		167		177	
158		168		178	
159		169		179	
160		170		180	
161		171		181	
162		172		182	

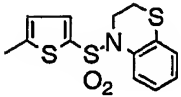
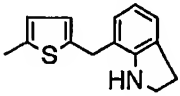
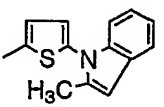
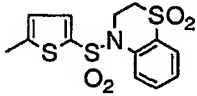
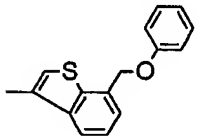
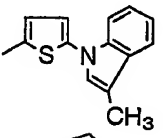
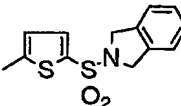
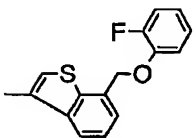
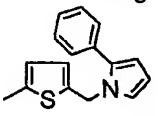
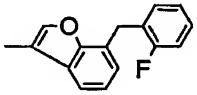
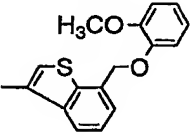
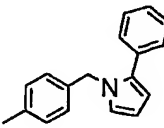
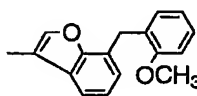
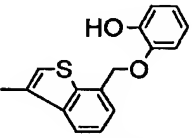
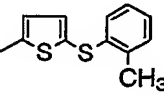
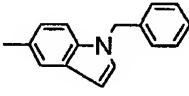
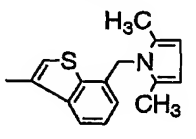
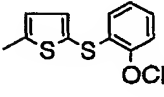
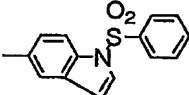
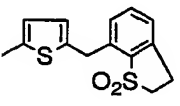
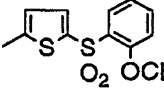
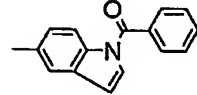
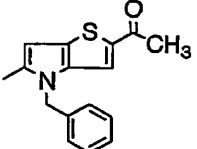
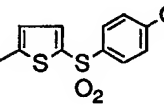
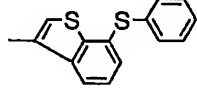
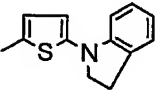
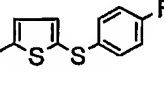
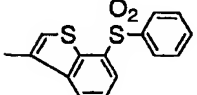
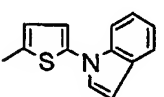
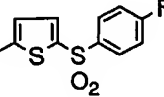
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
183 	193 	203 
184 	194 	204 
185 	195 	205 
186 	196 	206 
187 	197 	207 
188 	198 	208 
189 	199 	209 
190 	200 	210 
191 	201 	211 
192 	202 	212 

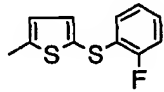
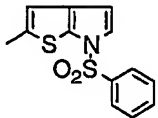
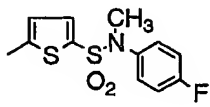
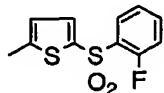
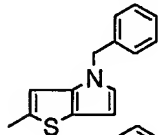
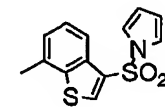
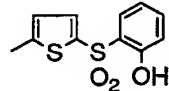
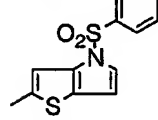
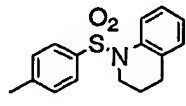
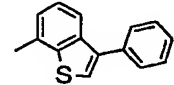
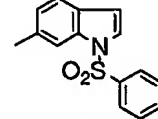
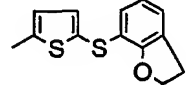
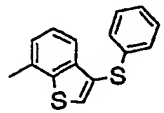
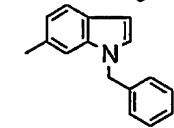
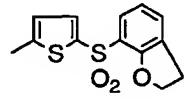
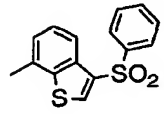
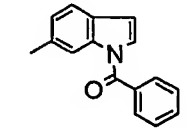
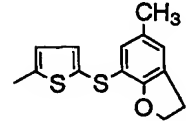
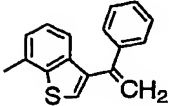
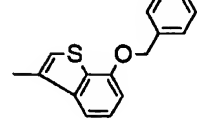
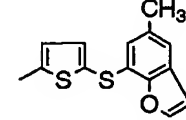
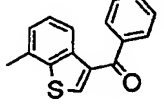
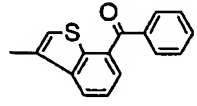
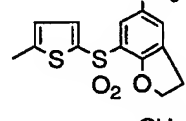
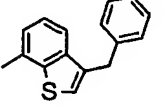
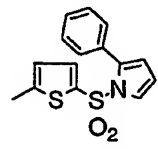
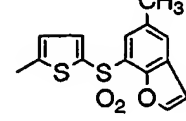
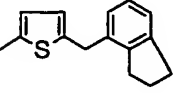
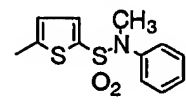
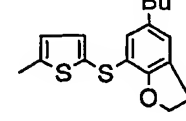




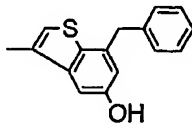
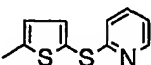
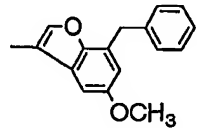
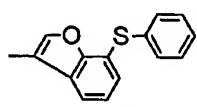
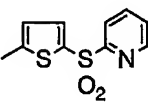
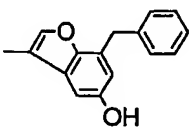
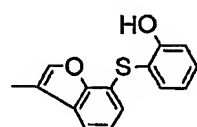
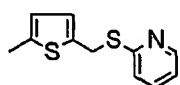
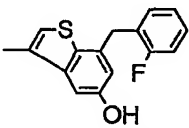
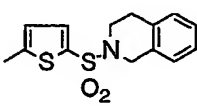
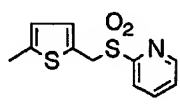
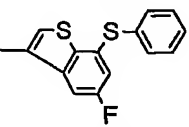
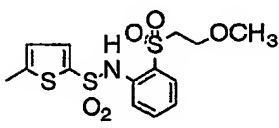
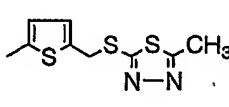
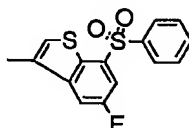
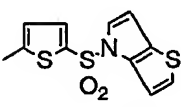
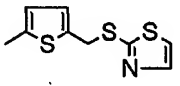
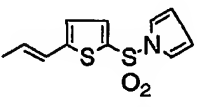
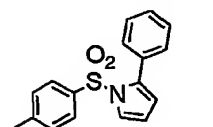
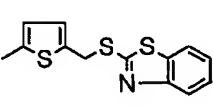
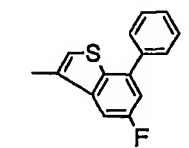
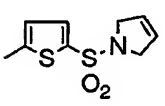
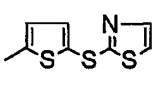
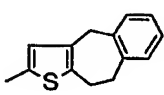
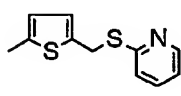
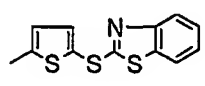
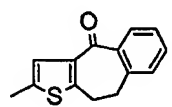
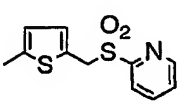
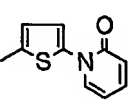
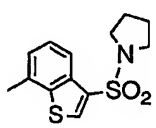
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
273	283	293
274	284	294
275	285	295
276	286	296
277	287	297
278	288	298
279	289	299
280	290	300
281	291	301
282	292	302
		303



$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
334 	344 	354 
335 	345 	355 
336 	346 	356 
337 	347 	357 
338 	348 	358 
339 	349 	359 
340 	350 	360 
341 	351 	361 
342 	352 	362 
343 	353 	363 

$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
364 	374 	384 
365 	375 	385 
366 	376 	386 
367 	377 	387 
368 	378 	388 
369 	379 	389 
370 	380 	390 
371 	381 	391 
372 	382 	392 
373 	383 	393 

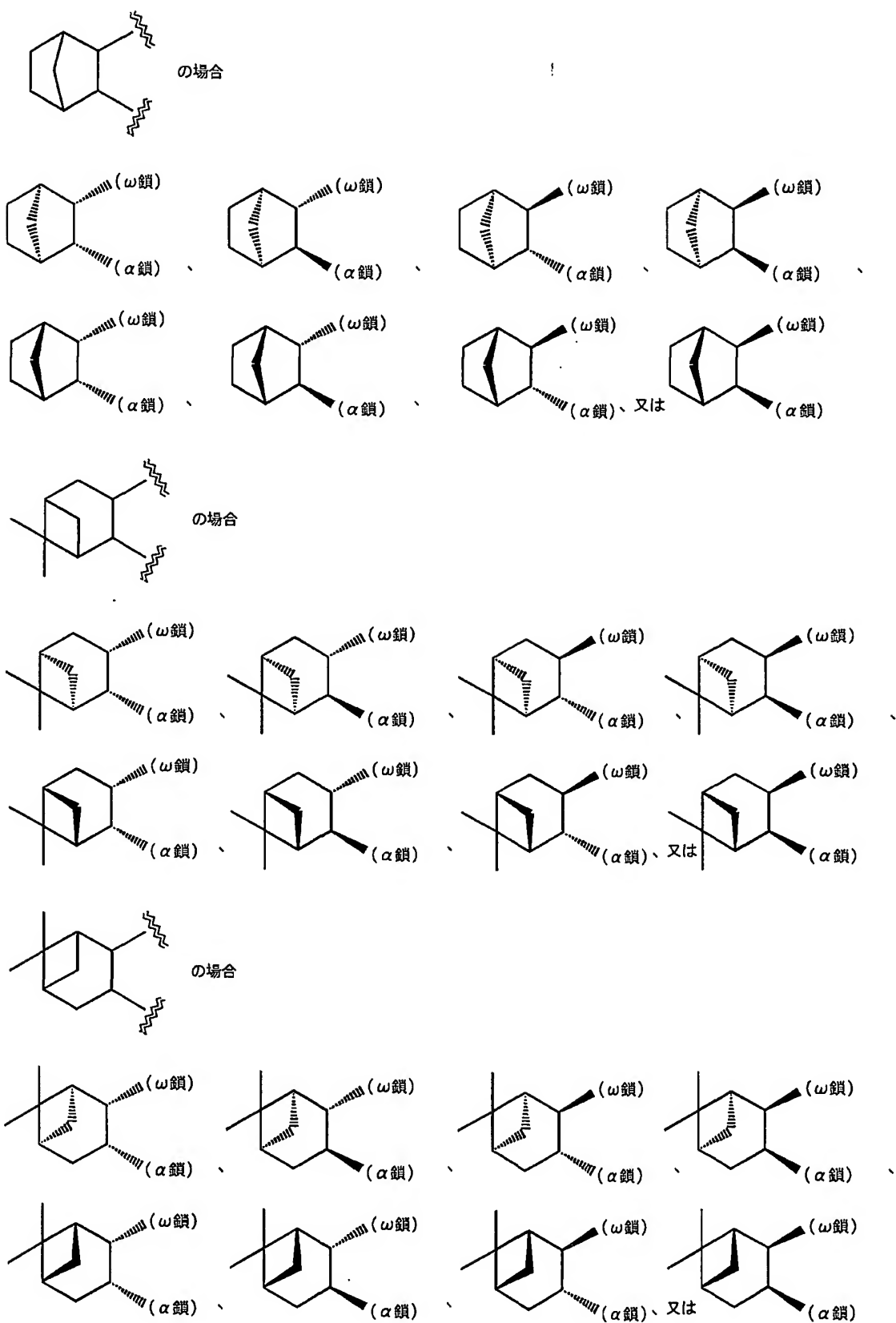
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
394	404	414
395	405	415
396	406	416
397	407	417
398	408	418
399	409	419
400	410	420
401	411	421
402	412	422
403	413	423

$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
424 	434 	444 
425 	435 	445 
426 	436 	446 
427 	437 	447 
428 	438 	448 
429 	439 	449 
430 	440 	450 
431 	441 	451 
432 	442 	452 
433 	443 	453 

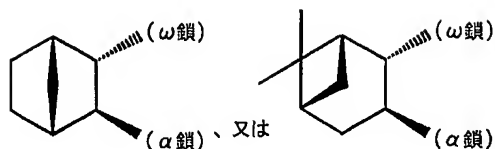
$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$
454	464	474
455	465	475
456	466	476
457	467	477
458	468	478
459	469	479
460	470	480
461	471	481
462	472	482
463	473	483

	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$	$-X^1-X^2-X^3$		
484		494		504	
485		495		505	
486		496		506	
487		497		507	
488		498		508	
489		499		509	
490		500		510	
491		501		511	
492		502		512	
493		503		513	

本発明化合物は〔2.2.1〕および〔3.1.1〕ビシクロ骨格に関して以下の立体異性体が存在し得る。



これらの化合物の中で、式：



で示される骨格を有する化合物が好ましい。

- 5 本発明はこれら個々の立体異性体を包含し、またそれらの任意の混合物をも包含する。即ち、本発明ではビシクロ環に結合する結合手は R 配置または S 配置のいずれでもよく、その全ての立体異性体（ジアステレオマー、エピマー、エナンチオマー等）、ラセミ体またはそれらの個々の化合物の任意の混合物を包含する。
- さらに、本発明化合物には α 鎖に関して Z 配置および E 配置が存在し得るが、
- 10 本発明はいずれかの配置を有する化合物、あるいはその両者の混合物を包含する。

- 式 (I) で示される化合物のプロドラッグとしては、化学的または代謝的に分解できる基を有する本発明に関する化合物の誘導体を意味し、加溶媒分解によりまたは生理学的条件下でインビボにおいて薬学的に活性な本発明に関する化合物
- 15 となる化合物である。適当なプロドラッグ誘導体を選択する方法および製造する方法は、例えば *Design of Prodrugs*, Elsevier, Amsterdam 1985 に記載されている。

- 式 (I) で示される化合物がカルボキシル基を有する場合は、もとになる酸性
- 20 化合物と適当なアルコールを反応させることによって製造されるエステル誘導体、またはもとになる酸性化合物と適当なアミンを反応させることによって製造されるアミド誘導体のようなプロドラッグが例示される。プロドラッグとして特に好ましいエステル誘導体としては、置換されていてもよいアルキルエステル誘導体（例えば、メチルエステル、エチルエステル、n-プロピルエステル、イソプロ
- 25 ビルエステル、n-ブチルエステル、イソブチルエステル、tert-ブチルエステル、

モルホリノエチルエステル等)、アリールアルキルエステル誘導体(例えば、ベンジルエステル、フェネチルエステル、ベンズヒドリルエステル等)等が挙げられる。アミド誘導体としては、アルキルアミド誘導体(N-メチルアミド、N-エチルアミド、N-(n-プロピル)アミド、N-イソプロピルアミド、N-(n-ブチル)アミド、
 5 N-イソブチルアミド、N-(tert-ブチル)アミド等)、アリールアルキルアミド誘導体(例えば、N-ベンジルアミド、N-フェネチルアミド、ベンズヒドリルアミド等)等が挙げられる。

式(I)で示される化合物がヒドロキシル基を有する場合は、例えばヒドロキシル基を有する化合物と適当なアシルハライドまたは適当な酸無水物とを反応させることに製造されるアシルオキシ誘導体のようなプロドラッグが例示される。
 10 プロドラッグとして特に好ましいアシルオキシ誘導体としては、置換されていてもよいアルキルカルボニルオキシ(例えば、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{15}\text{H}_{31}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COONa}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$)、置換されていてもよいアリールカルボニルオキシ(例えば、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-(\text{m}-\text{COONa}-\text{Ph})$ 等)等で置換されている誘導体等が挙げられる。

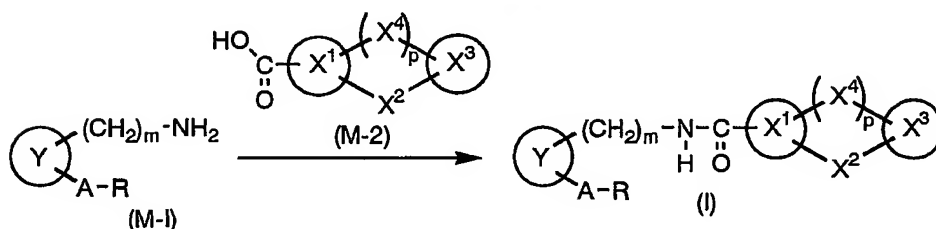
式(I)で示される化合物がアミノ基を有する場合は、アミノ基を有する化合物と適当な酸ハロゲン化物または適当な混合酸無水物とを反応させることにより製造されるアミド誘導体のようなプロドラッグが例示される。プロドラッグとして特に好ましいアミド誘導体としては、置換されていてもよいアルキルカルボニル(例えば、 $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 等)等で置換されている誘導体等が挙げられる。

式(I)で示される化合物またはそのプロドラッグの塩としては、アルカリ金属塩(例えば、リチウム塩、ナトリウム塩もしくはカリウム塩等)、アルカリ土
 25 類金属塩(例えば、カルシウム塩等)、有機塩基(例えば、トロメタミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、2-アミノブタン、tert-ブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、n-ブチルメチルアミン、シクロヘキシルアミン、ジシ

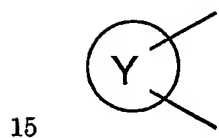
クロヘキシルアミン、N-イソプロピルシクロヘキシルアミン、フルフリルアミン、ベンジルアミン、メチルベンジルアミン、ジベンジルアミン、N, N-ジメチルベンジルアミン、2-クロロベンジルアミン、4-メトキシベンジルアミン、1-ナフチレンメチルアミン、ジフェニルベンジルアミン、トリフェニルアミン、1-ナフチルアミン、1-アミノアントラセン、2-アミノアントラセン、デヒドロアピエチルアミン、N-メチルモリホリンもしくはピリジン) との塩、またはアミノ酸塩（例えば、リジン塩もしくはアルギニン塩等）を挙げることができる。

溶媒和物とは、式 (I) で示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩の有機溶媒との溶媒和物および水和物などを意味し、例えば、1 水和物、2 水和物等を挙げることができる。

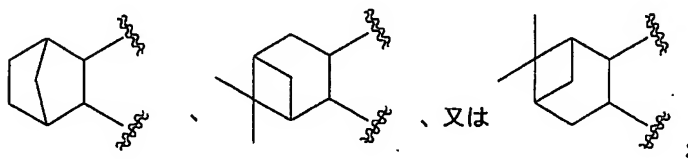
式 (I) で示される化合物の一般的調製法を以下に示す。



(式中、



は、



A はヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン；

20

Rは $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリル；

R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノ；

mは0または1；

但し、mが1であり、Aが $-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつ

- 5 Rが $-C(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合、
 およびmが0であり、Aが $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、
 かつRが $-C(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場
 合を除く；

pは0または1 ($p=0$ ときは、 X^1 と X^3 は X^4 を介して結合していない)；

- 10 X^1 および X^3 はそれぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されてい
 てもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基；

X^2 は単結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、
 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(CH_3)-$ 、 $-C(=N-O-CH_3)-$
 $-$ 、 $-N=N-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=O)-$

- 15 $-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-C$
 H_2-S- 、 $-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-SO_2-$ 、 $-SO_2-CH_2-$ 、 $-SO_2$
 $-NH-$ 、 $-NH-SO_2-$ 、 $-C(=CH_2)-$ 、 $-SO_2-N(Me)-$ 、 $-$
 $CH_2-NH-SO_2-$ 、 $-CH_2-NH-(C=O)-$ 、 $-NH-C(=O)-$
 $NH-$ または $-NH-C(=O)-N(Me)-$ ；

- 20 X^4 は $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、
 $-(C=O)-NH-$ 、 $-NH-(C=O)-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-NH-CH$
 $_2-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-CH$
 $_2-SO_2-$ 、 $-SO_2-CH_2-$ 、 $-SO_2-NH-$ 、または $-NH-SO_2-$ で
 ある。)

- 25 式(I)で示される化合物は上記の反応式に示されるように、式(M-1)で示
 されるアミノ化合物に式(M-2)で示されるカルボン酸またはその反応性誘導
 体を反応させることにより製造することができる。

式 (M-2) で示されるカルボン酸の反応性誘導体とは、対応する酸ハロゲン化物 (例えば、塩化物、臭化物、沃化物)、酸無水物 (例えば、ぎ酸、酢酸もしくはトリフルオロ酢酸との混合酸無水物)、活性エステル (例えば、*N*-ヒドロキシスクシンイミドエステル) などを意味し、通常アミノ基のアシル化に使用するアシル化剤を包含する。

例えば、酸ハロゲン化物とするときは、ハロゲン化チオニル (例えば、塩化チオニル)、ハロゲン化リン (例えば、三塩化リン、五塩化リン、塩化ホスホリル)、ハロゲン化オギザリル (例えば、塩化オギザリル) 等と公知の方法に従って反応させればよい。

反応は通常のアミノ基のアシル化反応の条件に従って行えばよく、例えば、酸ハロゲン化物による縮合反応の場合、溶媒としてエーテル系溶媒 (例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、ベンゼン系溶媒 (例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素系溶媒 (例えば、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム)、その他、酢酸エチル、*N*、*N*-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルなどを使用し、必要であれば塩基 (例えば、トリエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、*N*-メチルモルホリンなどの有機塩基、あるいは水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウムなどの無機塩基) の存在下、冷却下ないし室温あるいは加熱下、好ましくは -20℃ ないし氷冷下あるいは室温ないし反応系の加熱還流温度で、数分ないし数10時間、好ましくは 0.5 時間ないし 24 時間、より好ましくは 1 時間ないし 12 時間実施すればよい。

また、式 (M-1) で示される化合物の R がカルボキシル基でない場合は、カルボン酸 (M-2) を反応性誘導体とはせずに、遊離のまま使用することも可能であり、アミンとカルボン酸の縮合反応に使用する縮合剤 (例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カル

ボジイミド、*N*、*N'*-カルボニルジイミダゾール等)の存在下に反応させてもよい。

式(M-2)で示される化合物の X^1 または X^3 の「置換されていてもよいアリール」、「置換されていてもよいヘテロアリール」または「置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基」の置換基として、例えばヒドロキシ基、アミノ基が置換している場合は、常法に従ってアセチル基等で保護して反応させればよい。

他の反応性誘導体あるいは遊離の酸(M-2)とアミン(M-1)との反応においても、各反応性誘導体あるいは遊離酸の性質に応じて、公知の方法に従い、反応条件を定めればよい。反応生成物は通常の精製法、例えば、溶媒抽出、クロマトグラフィー、再結晶法などにより、精製することができる。

10

本発明目的化合物(I)において、Rが $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリル(R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノ)である各種誘導体は、RがCOOHである化合物から変換することもできる。例えば、エステル誘導体やアミド誘導体はカルボン酸を公知の方法に従いエステル化あるいはアミド化することにより製造することができる。また、エステル誘導体を還元すればアルコール誘導体とすることができるし、さらにO-アルキル化することによってエーテル誘導体へと変換することも可能である。Rが5-テトラゾリルである化合物は、RがCONH₂であるアミド誘導体を常法に従って脱水反応を行ない、RがCNである化合物に変換後、さらにアジ化ナトリウム(*J. Am. Chem. Soc.* 1958, 80, 3908)あるいはアジ化トリメチルシラン(*J. Org. Chem.* 1993, 58, 4139)と反応させることにより製造することができる。

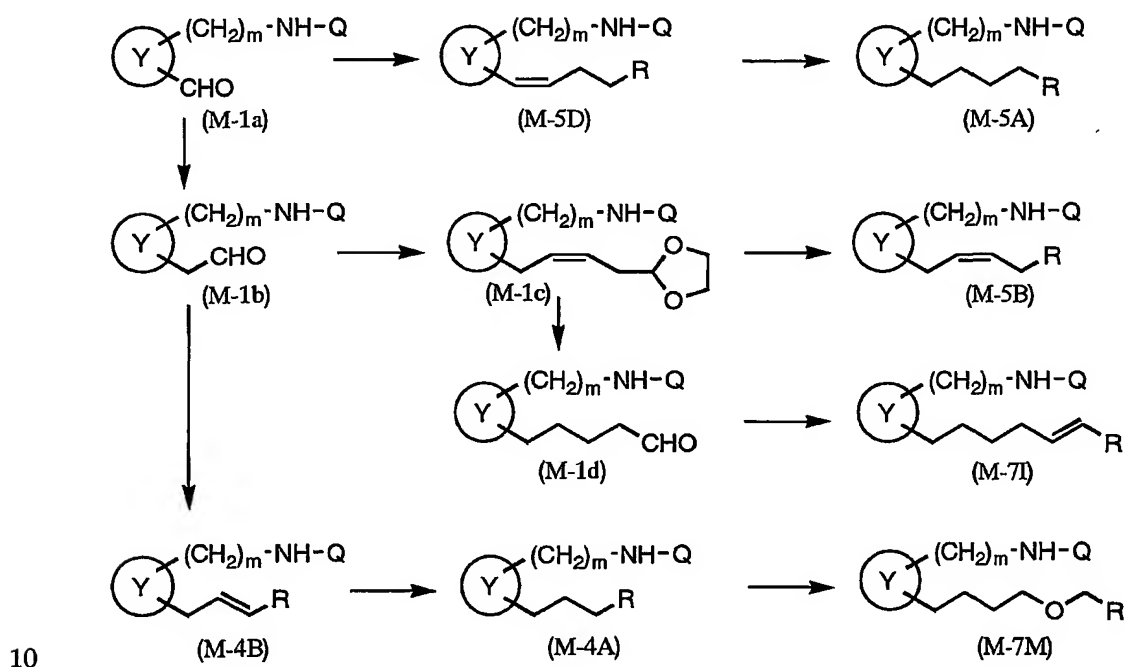
15

20

本反応における原料化合物(M-1)中、-A-Rが式： $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-COOMe$ で示される基であり、 $m=0$ であり、Yが[2.2.1]ビシクロ骨格である化合物、即ち7-(3-アミノ-ビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-5-ヘプテン酸メチルは、特公平5-79060号公報に記載された公知化合物で

25

ある。その他の原料化合物も一般式 (M-1 a) あるいは (M-1 b) で表わされるアルデヒド誘導体 (Q は、ベンジルオキシカルボニルあるいはトートキシカルボニル等の保護基) に、適宜他の化学反応を組み合わせながら、各種イリド化合物をウィッティッヒ (Wittig) 反応 (オーガニック・リアクション、
 5 1965、14、270) の条件にしたがって一回ないし数回反応させることにより製造することができる。また、原料化合物において、R が $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリル (R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてよいアミノ) である各種誘導体は、前記と同様に R が COOH である化合物から変換することもできる。



例えば、アルデヒド (M-1 a) に (3-カルボキシプロピル) トリフェニルホスホニウム塩を公知のウィッティッヒ反応条件に従って反応させると、式 (M-1) において A が $-CH=CHCH_2CH_2-$ に相当する原料化合物 (M-5 D) が得られ、さらにパラジウム、白金等の触媒存在下、水素添加を行なうと、A が
 15 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ に相当する原料化合物 (M-5 A) が得られる。また、メトキシメチルトリフェニルホスホニウム塩を用いたウィッティッヒ反応後、塩酸、ぎ酸あるいは酢酸等による加水分解を行なうと一炭素増炭したアルデヒド (M

−1 b) が得られ、さらに 2-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)エチルトリ
フェニルホスホニウム塩を用いたウィッティッヒ反応で一般式 (M-1 c) で表
わされる化合物へ誘導できる。この化合物をジョーンズ酸化 (J. Chem. S
oc., 1946, 39) すると、式 (M-1) において A が $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$
5 CH_2- に相当する原料化合物 (M-5 B) が得られ、また上記と同様に水素添加、
アセタールの酸加水分解でアルデヒド (M-1 d) とした後、(トリフェニルホ
スホラニリデン) 酢酸メチル等の安定イリドとのウィッティッヒ反応を行なうか、
あるいはジメチルホスホ酢酸メチル等を用いたホーナー・エモンズ (Horn
er-Emmons) 反応を行なって A が $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$
10 に相当する原料化合物 (M-7 I) に変換することが可能である。アルデヒド (M
-1 b) に対し直接上記反応を適用すると、A が $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ に相当す
る原料化合物 (M-4 B) が得られ、さらに 2 重結合の水素添加で A が $-\text{CH}_2$
 CH_2CH_2- に相当する原料化合物 (M-4 A) が得られる。A が $-\text{CH}_2\text{CH}$
 $_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ に相当する原料化合物 (M-7 M) が必要な場合は、
15 式 (M-4 A) の R が CH_2OH である化合物に、塩基存在下、ハロゲン化酢酸も
しくはそのエステル誘導体、エーテル誘導体、アミド誘導体等を公知の方法に従
がって反応させれば良い。

また原料カルボン酸 (M-2) とのアミド化は、必要に応じて、目的とする α
鎖への変換途中の段階でアミノ基の保護基 Q を脱保護し、行なうことも可能であ
20 る。

式 (M-2) で示されるカルボン酸は、p が 0 の場合、 X^1 を有するカルボン酸
またはその反応性誘導体と X^3 を有する化合物を結合させることにより得られる。
結合反応は、 X^2 の種類により、それぞれ反応および条件を選択して、当業者なら
容易に行うことができる。

25 特に、式: $\text{X}^3-\text{X}^2-\text{X}^1-\text{COOH}$ (式中、 X^3 はアルキル、アルキルオキシ
またはハロゲンで置換されていてもよいピロリル、アルキル、アルキルオキシま
たはハロゲンで置換されていてもよいインドリル、アルキル、アルキルオキシま

たはハロゲンで置換されていてもよいインドリニルまたはアルキル、アルキルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよい1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、 X^2 は $-SO_2-$ 、 $-S-$ または $-CH_2-$ 、 X^1 はチエニルである)で示される化合物またはその塩、特に、式: $-X^1-X^2-X^3$ で示される基が、5-[(1-ピロリル) スルホニル] -チオフェン-2-イル、5-[(2-メチル-1-ピロリル) スルホニル] -チオフェン-2-イルまたは5-[(2, 5-ジメチル-1-ピロリル) スルホニル] -チオフェン-2-イルである上記の化合物またはその塩は、中間体として重要である。塩としては、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、トリエチルアンモニウム塩、ピリジン塩などが
10 挙げられる。

なお、 p が0である場合、化合物(I)の式: $-NHCO-X^1-X^2-X^3$ で示される基は、上記のように、カルボン酸またはその反応性誘導体である $X^3-X^2-X^1-COOH$ (M-2)を用いて、アミン(M-1)との反応によって導入してもよいし、 X^1 を有するカルボン酸またはその反応性誘導体とアミン(M-1)との反応後に、 X^3 を有する化合物を反応させて導入してもよい。
15

「置換されていてもよいアリール」、「置換されていてもよいヘテロアリール」または「置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基」上に置換基を導入する場合は、カルボン酸またはその反応性誘導体(M-2)とアミン(M-1)との反応前または反応後に、官能基変換を行えばよい。
20

アリール、ヘテロアリール等の芳香環部分については、芳香環について知られている通常の官能基の導入、変換を行うことができる。例えば、混酸等を用いてニトロ化を行い、ニトロ基で置換された化合物を得ることができる。さらに、塩酸中、すず等を用いて還元することによって、アミノ基で置換された化合物を得ることができる。さらに、ジアゾ化を行い、アルカリ加水分解を行うことにより、ヒドロキシ基で置換された化合物を得ることができる。また、ジアゾ体にアルコールを反応させることにより、アルコキシ基で置換された化合物を得ることがで
25

きる。また、サンドマイヤー反応、すなわち、ジアゾ体に第一銅塩 (CuCl_2 、 CuBr 等) を反応させることにより、ハロゲンに置換された化合物を得ることができる。また、ハロゲンに置換された化合物は、芳香環を有する化合物に直接塩素等を反応することによっても得ることができる。これらの方法を使い分ける
5 ことにより、ハロゲンを所望の位置に導入することができる。アルキル、アルケニル、アシルは、無水塩化アルミニウム等とアルキル化剤、アルケニル化剤、アシル化剤を用いて、フリーデルクラフツ反応により、直接芳香環に導入することができる。

式 (I) で示される化合物において、所望により、対応するエステル誘導体と
10 することもできる。例えば、エステル誘導体はカルボン酸を公知の方法に従いエステル化することにより製造することができる。

式 (I) で示される化合物を治療に用いるには、通常の経口または非経口投与用の製剤として製剤化する。本発明に関する化合物を含有する医薬組成物は、経
15 口および非経口投与のための剤型をとることができる。即ち、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤などの経口投与製剤、あるいは、静脈注射、筋肉注射、皮下注射などの注射用溶液または懸濁液、吸入薬、点鼻薬、坐剤、点眼剤もしくは軟膏剤などの経皮投与用製剤などの非経口製剤とすることもできる。

これらの製剤は当業者既知の適当な担体、賦形剤、溶媒、基剤等を用いて製造
20 することができる。例えば、錠剤の場合、活性成分と補助成分と一緒に圧縮または成型する。補助成分としては、製剤的に許容される賦形剤、例えば結合剤 (例、トウモロコシでん粉)、充填剤 (例、ラクトース、微結晶性セルロース)、崩壊剤 (例、でん粉グリコール酸ナトリウム) または滑沢剤 (例、ステアリン酸マグネシウム) などが用いられる。錠剤は、適宜、コーティングしてもよい。シロップ
25 剤、液剤、懸濁剤などの液体製剤の場合、例えば、懸濁化剤 (例、メチルセルロース)、乳化剤 (例、レシチン)、保存剤などを用いる。注射用製剤の場合、溶液、懸濁液または油性もしくは水性乳濁液の形態のいずれでもよく、これらは

懸濁安定剤または分散剤などを含有していてもよい。吸入剤として使用する場合は吸入器に適応可能な液剤として用いる。

- 特に鼻閉症治療のための点鼻薬として用いる場合、通常の製剤化の方法に従って、液剤、懸濁化剤として用いるか、あるいは粉末化剤（例、ヒドロキシプロピルセルロース、カーボポール）等を加え、粉末剤として鼻孔に加える。あるいは、低沸点の溶媒とともに特殊な容器に充填し、噴射剤として用いることができる。

- また、アレルギー性結膜炎治療のための点眼薬として用いる場合、本発明化合物を溶液または懸濁液として使用してもいいし、用時溶解または用時懸濁して使用してもよい。また、安定剤、溶解補助剤、懸濁化剤、乳化剤、緩衝液、保存剤等を含むとしてもよい。また、点眼薬として使用する場合は、特に無菌処理しておくことが好ましい。

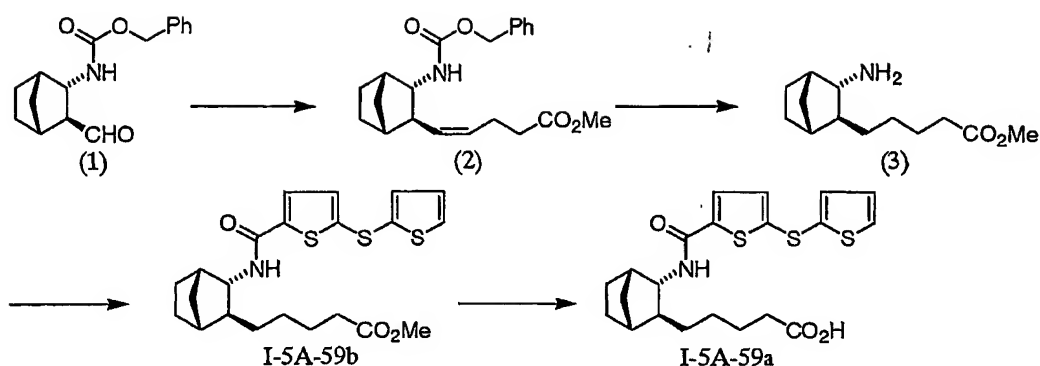
また、抗喘息剤としては、注射剤、経口剤、吸入剤等として製剤化するのが好ましい。

- 本発明に関する化合物の投与量は、投与形態、患者の症状、年齢、体重、性別、あるいは併用される薬物（あるとすれば）などにより異なり、最終的には医師の判断に委ねられるが、経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.01～100 mg、好ましくは0.01～10 mg、より好ましくは0.01～1 mg、非経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.001～100 mg、好ましくは0.001～1 mg、より好ましくは0.001～0.1 mgを投与する。これを1～4回に分割して投与すればよい。

実施例

- 以下に実施例を挙げて本発明を詳しく説明するが、これらは単なる例示であり、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1 化合物（I-5A-59a）、（I-5A-59b）の合成



第 1 工程

(3-カルボキシプロピル) トリフェニルホスホニウムブロミド (9.42 g、
 22.0 mmol) の THF (45 ml) 懸濁液に氷冷下カリウム *t*-ブトキシ
 5 ド (4.32 g、38.5 mmol) を加え、1 時間攪拌した。反応混合物を-
 10℃に冷却し、化合物 (1) (3.0 g、11.0 mmol) の THF (15
 ml) 溶液を 15 分かけて滴下し、同温度でさらに 1 時間攪拌した。反応液を水
 で希釈、トルエンで 2 回洗浄後、水層を塩酸で酸性 (pH = 1) とし、酢酸エチ
 10 ルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、得られた残渣の
 酢酸エチル (20 ml) 溶液に、氷冷下過剰のジアゾメタン-エーテル溶液を加
 えた。反応液を濃縮後、シリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、
 85 : 15) で精製し、化合物 (2) (3.32 g ; 収率 85%) を得た。

第 2 工程

15 化合物 (2) (3.22 g、9.0 mmol) のメタノール (30 ml) 溶液
 に、10%パラジウム-炭素 (0.32 g) を加え、水素雰囲気下、17 時間攪
 拌した。反応液をろ過、濃縮し、化合物 (3) (2.05 g ; 収率 100%) を
 得た。

20 第 3 工程

化合物 (3) (180 mg、0.80 mmol) の THF (8 ml) 溶液に、
 5-(2-チエニルチオ) チオフェン-2-カルボン酸 (233 mg、0.96

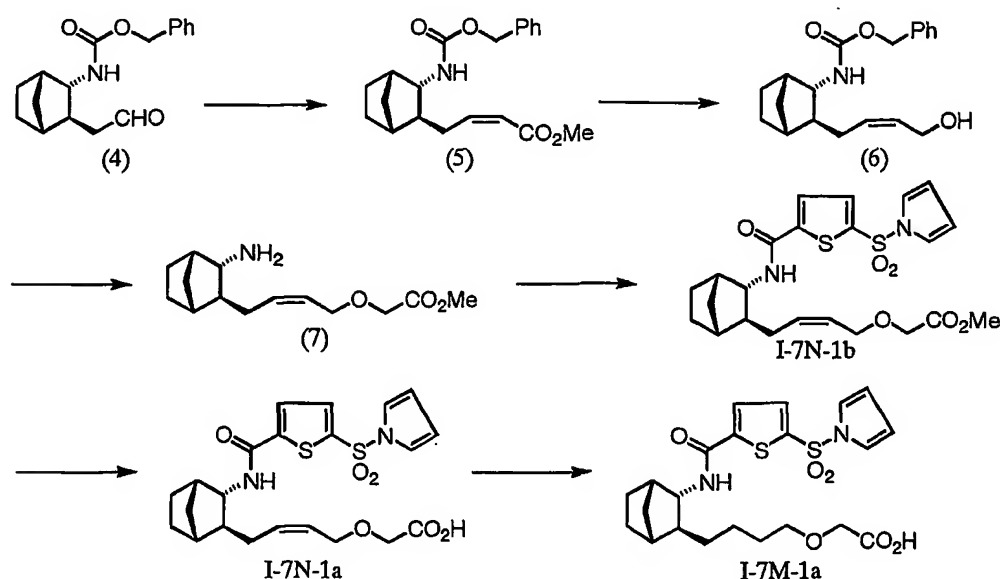
mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(10.8mg、0.08mmol)を加え、さらに氷冷下1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド(149mg、0.96mmol)を加えた。反応混合物を室温で14時間攪拌した後、酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル、5:1)で精製し、化合物(I-5A-59b)(325mg; 収率90%)を得た。

第4工程

10 化合物(I-5A-59b)(325mg、0.72mmol)のTHF(8ml)溶液に、1N水酸化リチウム水溶液(1.8ml、1.8mmol)を加え、室温で14時間攪拌した。反応液を酸性とした後、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮し、化合物(I-5A-59a)(300mg; 収率96%)を得た。

15

実施例2 化合物(I-7M-1a)、(I-7N-1a)、(I-7N-1b)の合成



第1工程

ビス(2, 2, 2-トリフルオロエチル)ホスホノ酢酸メチル(2.94 ml、
13.92 mmol)と18-クラウン-6(5.52 g、20.88 mmol)
5 のTHF(100 ml)溶液を-60℃に冷却し、ビス(トリメチルシリル)ア
ミドカリウム(0.5 Mトルエン溶液、27.8 ml、13.9 mmol)を滴
下し、さらに15分攪拌した。化合物(4)(2.0 g、6.96 mmol)の
THF(20 ml)溶液を15分かけて滴下し、同温度でさらに2時間攪拌した。
0℃まで昇温した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液
10 を水、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮後、残渣をシリカゲルクロマトグラフ
ィー(ヘキサン-酢酸エチル、4:1)で精製し、化合物(5)(2.10 g;
収率88%)を得た。

第2工程

15 化合物(5)(1.80 g、5.24 mmol)のジクロロメタン(20 ml)
-ヘキサン(20 ml)溶液を-78℃に冷却し、水素化ジイソプロピルアルミ
ニウム(1 Mトルエン溶液、13.1 ml、13.1 mmol)を滴下した。同
温度で1時間攪拌した後、メタノール(1 ml)を加え、室温まで昇温した。反
応液に2 N塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を炭酸水素ナトリウム、
20 飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮後、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘ
キサン-酢酸エチル、7:3)で精製し、化合物(6)(5.92 g; 収率96%)
を得た。

第3工程

25 化合物(6)(1.58 g、5.01 mmol)のトルエン(15 ml)溶液
に、プロモ酢酸 t-ブチル(1.05 ml、6.50 mmol)、硫酸水素テト
ラブチルアンモニウム(170 mg、0.5 mmol)、50%水酸化ナトリウ

ム (4 ml) を加え、室温で 18 時間激しく攪拌した。トルエン層を分離し水、飽和食塩水で順次洗浄後、乾燥、濃縮した。得られた残渣に、トリフルオロ酢酸 (6.38 ml、83 mmol) とアニソール (3.37 ml、31 mmol) を加え、60 °C で 15 時間加熱攪拌した。反応液を減圧下濃縮、油状残渣をヘキサンで洗浄した後、メタノール (20 ml) と濃硫酸 (0.44 ml) を加え、さらに 2 時間加熱還流した。反応混合物に 2 N 水酸化ナトリウムを加えアルカリ性とした後、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮し、化合物 (7) (461 mg; 収率 44%) を得た。

10 第 4 工程

化合物 (7) (215 mg、0.85 mmol) の THF (6 ml) 溶液に、5-(2-メチル-1-ピロリルスルホニル)チオフェン-2-カルボン酸 (218 mg、0.85 mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (13 mg、0.09 mmol) を加え、さらに氷冷下 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド (137 mg、1.02 mmol) を加えた。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した後、酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、2:1) で精製し、化合物 (I-7N-1b) (328 mg; 収率 78%) を得た。

20

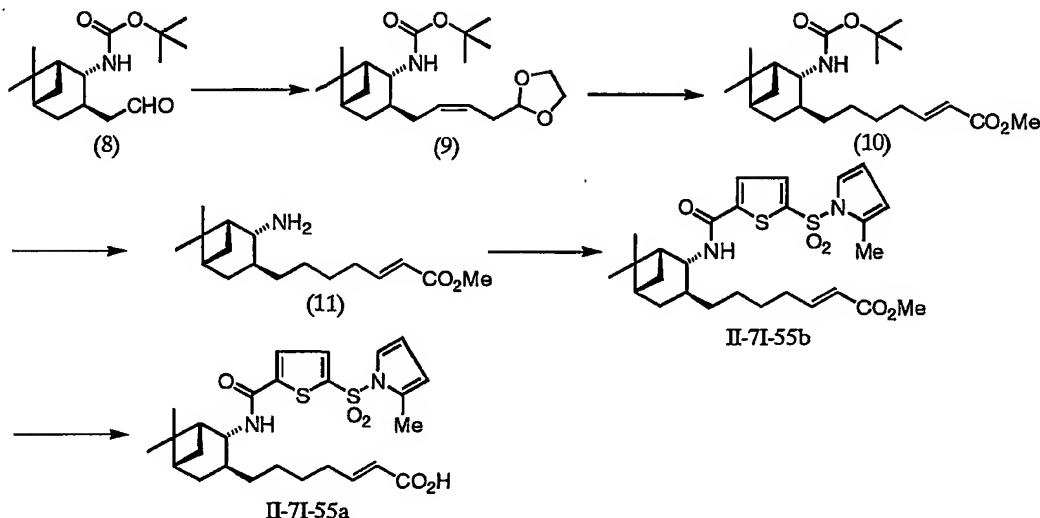
第 5 工程

化合物 (I-7N-1b) (310 mg、0.63 mmol) の THF (3.2 ml) -メタノール (6.3 ml) 溶液に、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (1.57 ml、1.57 mmol) を加え、室温で 16 時間攪拌した。反応液に 2 N 塩酸を加え酸性とした後酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮し、化合物 (I-7N-1a) (399 mg; 収率 73%) を得た。

第6工程

化合物 (I - 7 N - 1 a) (1 7 0 m g 、 0 . 3 6 m m o l) のメタノール
(5 m l) 溶液に、10%パラジウム-炭素 (8 5 m g) を加え、水素雰囲気下、
5 17時間攪拌した。反応液をろ過、濃縮し、化合物 (I - 7 M - 1 a) (1 6
2 m g 、 収率 9 5 %) を得た。

実施例3 化合物 (I I - 7 I - 5 5 a) , (I I - 7 I - 5 5 b) の合成



10 第1工程

2 - (1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル) エチルトリフェニルホスホニウムブ
ロミド (1 3 . 2 8 g 、 3 0 . 0 m m o l) の T H F (6 0 m l) 懸濁液を - 3
0 ° C に冷却し、カリウム *t* - ブトキシド (6 . 7 3 g 、 6 0 . 0 m m o l) を加
え、 - 3 0 ° C から 0 ° C で 1 時間攪拌した。反応混合物を再び - 2 5 ° C に冷却し、
15 化合物 (8) (5 . 6 2 g 、 2 0 . 0 m m o l) の T H F (4 0 m l) 溶液を 1
5 分かけて滴下した。0 ° C まで昇温し、さらに 1 . 5 時間攪拌した後、反応液を
水で希釈し、酢酸エチルで抽出、抽出液を水、飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し
た。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン - 酢酸エチル、 8
5 : 1 5) で精製し、化合物 (9) (6 . 2 7 g ; 収率 8 6 %) を得た。

第2工程

化合物(9) (4.10 g、11.2 mmol) のメタノール(41 ml) 溶液に、10%パラジウム-炭素(0.21 g)を加え、水素雰囲気下、2時間攪拌した。反応液をろ過、濃縮し、残渣(4.12 g; 収率100%)を得た。この粗生成物(3.68 g、10.0 mmol)のアセトン-水(4:1、50 ml)溶液に、p-トルエンスルホン酸ピリジニウム(503 mg、2.0 mmol)を加え、16時間加熱還流した。反応液を水で希釈し、酢酸エチルで抽出、抽出液を水、飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した。得られた残渣のトルエン(35 ml)溶液に、(トリフェニルホスホラニリデン)酢酸メチル(2.93 g、8.76 mmol)を加え、室温で18時間攪拌した。酢酸エチルで希釈後、水、飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル、85:15)で精製し、化合物(10) (2.71 g; 収率71%)を得た。

15

第3工程

化合物(10) (2.35 g、6.19 mmol) のジクロロメタン(38 ml)溶液に、トリフルオロ酢酸(3.82 ml、49.5 mmol)を加え、室温で3時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮後、トルエン(50 ml)と水(100 ml)に溶解し、水層がアルカリ性(pH=10)になるまで2N水酸化ナトリウムを加えた。トルエン層を分離後、水、飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、化合物(11) (1.70 g、収率98%)を得た。

20

第4工程

化合物(11) (433 mg、1.55 mmol) のTHF(6 ml)溶液に、5-(2-メチル-1-ピロリルスルホニル)チオフェン-2-カルボン酸(400 mg、1.47 mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(20 mg、

25

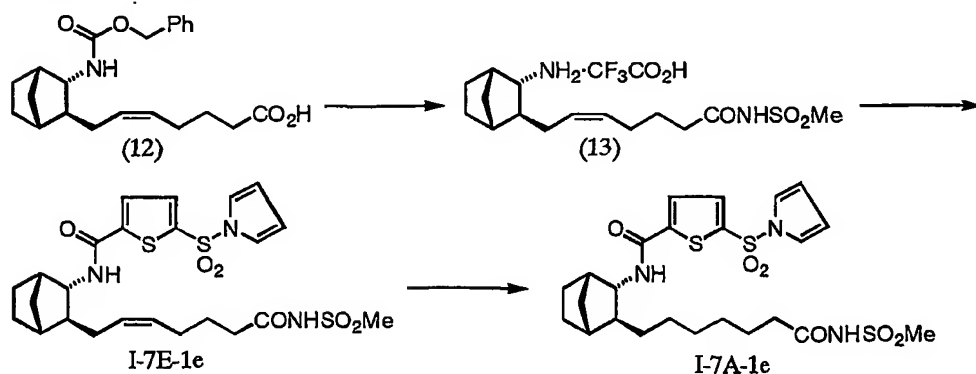
0.15 mmol) を加え、さらに氷冷下 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノ
 プロピル)-カルボジイミド (252 mg、1.62 mmol) を加えた。反応
 混合物を室温で 16 時間攪拌した後、酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナ
 トリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフ
 5 ー (ヘキサン-酢酸エチル、4:1) で精製し、化合物 (II-7I-55b)
 (585 mg; 収率 74%) を得た。

第 5 工程

化合物 (II-7I-55b) (560 mg、1.05 mmol) の THF (8
 10 ml) 溶液に、2N 水酸化リチウム水溶液 (1.58 ml、3.15 mmol)
 を加え、室温で 48 時間攪拌した。反応液に 2N 塩酸を加え酸性とした後、酢酸
 エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した。乾燥、濃縮後、残渣
 をシリカゲルクロマトグラフー (ヘキサン-酢酸エチル、1:3) で精製し、
 化合物 (II-7I-55a) (399 mg; 収率 73%) を得た。

15

実施例 4 化合物 (I-7A-1e), (I-7E-1e) の合成



第 1 工程

20 化合物 (12) (840 mg、2.26 mmol) のジクロロメタン (20 ml)
 溶液に、氷冷下塩化オキサリル (0.236 ml、2.71 mmol) と N,
 N-ジメチルホルムアミド (1 滴) を加え、30 分間攪拌した。反応混合物を減

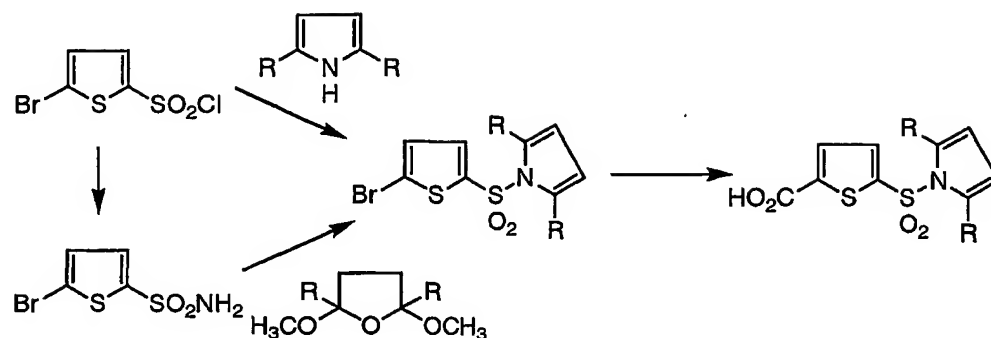
圧下濃縮し、ジクロロメタン (20 ml) に溶解後、メタンスルホンアミド (258 mg、2.71 mmol) と 1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン (0.744 ml、4.97 mmol) を加え、2.5 時間反応した。反応液を酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水
5 で順次洗浄、乾燥、濃縮した。得られた残渣に、トリフルオロ酢酸 (25 ml) とアニソール (2 ml、18.40 mmol) を加え、50°C で 13 時間加熱攪拌した。反応液を減圧下濃縮、油状残渣をヘキサンで洗浄し、化合物 (13) (0.776 g; 収率 65%) を得た。

10 第 2 工程

5- (1-ピロリルスルホニル) チオフェン-2-カルボン酸 (209 mg、0.812 mmol) のジクロロメタン (4 ml) 溶液に、氷冷下塩化オキサリル (0.081 ml、0.929 mmol) と N,N-ジメチルホルムアミド (1滴) を加え、20 分間攪拌した。室温でさらに 40 分反応後、減圧下濃縮乾固し、
15 再びジクロロメタン (4 ml) に溶解した。化合物 (13) (0.42、0.774 mmol) のジクロロメタン (4 ml) - THF (3 ml) 溶液とトリエチルアミン (0.486 ml、3.49 mmol) を氷冷下加え、1 時間攪拌した後、室温で更に 19 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカ
20 ゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル-酢酸、1:1:0.003) で精製し、化合物 (I-7E-1e) (157 mg; 収率 37%) を得た。

第 3 工程

化合物 (I-7E-1e) (116 mg、0.21 mmol) のメタノール
25 (3 ml) 溶液に、20% 水酸化パラジウム-炭素 (64 mg) を加え、水素雰囲気下、20 時間攪拌した。反応液をろ過、濃縮し、化合物 (I-7A-1e) (109 mg; 収率 94%) を得た。

実施例5 化合物(式: $X^3-X^2-X^1-COOH$) の合成

塩化5-ブロモチオフェン-2-スルホニルに直接ピロール誘導体を反応させるか、または塩化スルホニルをスルホンアミドに変換後、2,5-ジメトキシテトラヒドロフラン誘導体と縮合してスルホニルピロールへと誘導した。続いてハロゲン-金属交換反応により、有機リチウムあるいは有機マグネシウム化合物に変換し、二酸化炭素と反応させることにより製造した。

10 5-(1-ピロリルスルホニル)-2-チオフェンカルボン酸

mp 191-194 °C; ¹H-NMR (CDCl₃) δ 6.36 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.18 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.61 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.74 (1H, d, J = 4.2 Hz).

5-(2-メチル-1-ピロリルスルホニル)-2-チオフェンカルボン酸

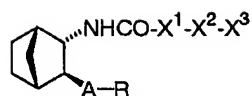
15 mp 159-160 °C; ¹H-NMR (CDCl₃) δ 2.40 (3H, d, J = 0.9 Hz), 6.01 (1H, m), 6.23 (1H, t, J = 3.0 Hz), 7.20 (1H, dd, J = 1.8, 3.6 Hz), 7.58 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.76 (1H, d, J = 4.2 Hz).

20 5-(2,5-ジメチル-1-ピロリルスルホニル)-2-チオフェンカルボン酸

mp 167-171 °C; ¹H-NMR (CDCl₃) δ 2.43 (6H, s), 5.90 (2H, s), 7.52 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.75 (1H, d, J = 3.9 Hz).

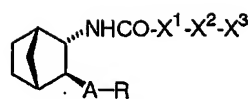
上記実施例と同様にして製造した化合物および物性値を以下の表に示す。表中の $-X^1-X^2-X^3$ およびAに使用される各記号は、上述の各記号を意味する。

表 1



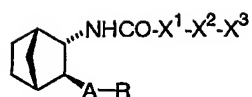
化合物番号	-X ¹ -X ² -X ³	A	R
I-4A-1a	1	4A	CO ₂ H
I-4B-1a	1	4B	CO ₂ H
I-4C-1a	1	4C	CO ₂ H
I-4D-1a	1	4D	CO ₂ H
I-4E-1a	1	4E	CO ₂ H
I-4F-1a	1	4F	CO ₂ H
I-5A-1a	1	5A	CO ₂ H
I-5A-1b	1	5A	CO ₂ Me
I-5A-31a	31	5A	CO ₂ H
I-5A-47a	47	5A	CO ₂ H
I-5A-55a	55	5A	CO ₂ H
I-5A-59a	59	5A	CO ₂ H
I-5A-59b	59	5A	CO ₂ Me
I-5A-80a	80	5A	CO ₂ H
I-5A-88a	88	5A	CO ₂ H
I-5A-88b	88	5A	CO ₂ Me
I-5A-104a	104	5A	CO ₂ H
I-5A-126a	126	5A	CO ₂ H
I-5A-143a	143	5A	CO ₂ H
I-5A-197a	197	5A	CO ₂ H
I-5B-1a	1	5B	CO ₂ H
I-5B-47a	47	5B	CO ₂ H
I-5B-59a	59	5B	CO ₂ H
I-5C-1a	1	5C	CO ₂ H
I-5C-1b	1	5C	CO ₂ Me
I-5C-55a	55	5C	CO ₂ H
I-5C-31a	31	5C	CO ₂ H
I-5C-47a	47	5C	CO ₂ H
I-5C-88a	88	5C	CO ₂ H
I-5D-1a	1	5D	CO ₂ H
I-5E-1a	1	5E	CO ₂ H
I-5E-55a	55	5E	CO ₂ H
I-5F-1a	1	5F	CO ₂ H
I-5F-47a	47	5F	CO ₂ H
I-5G-47a	47	5G	CO ₂ H
I-6A-1a	1	6A	CO ₂ H
I-6A-31a	31	6A	CO ₂ H
I-6A-55a	55	6A	CO ₂ H
I-6A-88a	88	6A	CO ₂ H
I-6B-1a	1	6B	CO ₂ H
I-6B-31a	31	6B	CO ₂ H
I-6B-88a	88	6B	CO ₂ H
I-6C-1a	1	6C	CO ₂ H

表 2



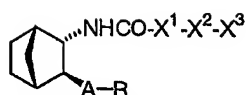
化合物番号	$-X^1-X^2-X^3$	A	R
I-6D-1a	1	6D	CO_2H
I-6E-1a	1	6E	CO_2H
I-6E-59a	59	6E	CO_2H
I-6F-1a	1	6F	CO_2H
I-6G-1a	1	6G	CO_2H
I-7A-1a	1	7A	CO_2H
I-7A-1b	1	7A	CO_2Me
I-7A-1c	1	7A	$CONH_2$
I-7A-1e	1	7A	$CONHSO_2Me$
I-7A-1h	1	7A	CH_2OH
I-7A-1i	1	7A	CH_2OMe
I-7A-31a	31	7A	CO_2H
I-7A-47a	47	7A	CO_2H
I-7A-47i	47	7A	CH_2OMe
I-7A-55a	55	7A	CO_2H
I-7A-59a	59	7A	CO_2H
I-7A-80a	80	7A	CO_2H
I-7A-88a	88	7A	CO_2H
I-7A-88e	88	7A	$CONHSO_2Me$
I-7A-88h	88	7A	CH_2OH
I-7A-88i	88	7A	CH_2OMe
I-7A-104a	104	7A	CO_2H
I-7A-143a	143	7A	CO_2H
I-7A-197a	197	7A	CO_2H
I-7A-315a	315	7A	CO_2H
I-7A-316a	316	7A	CO_2H
I-7B-1a	1	7B	CO_2H
I-7C-1a	1	7C	CO_2H
I-7D-1a	1	7D	CO_2H
I-7E-1c	1	7E	$CONH_2$
I-7E-1d	1	7E	$CONHMe$
I-7E-1e	1	7E	$CONHSO_2Me$
I-7E-1f	1	7E	$CON(Me)SO_2Me$
I-7E-1g	1	7E	5-tetrazolyl
I-7E-1h	1	7E	CH_2OH
I-7E-1i	1	7E	CH_2OMe
I-7E-47c	47	7E	$CONH_2$
I-7E-47i	47	7E	CH_2OMe
I-7E-88e	88	7E	$CONHSO_2Me$
I-7E-88h	88	7E	CH_2OH
I-7E-88i	88	7E	CH_2OMe
I-7F-1a	1	7F	CO_2H

表 3



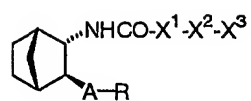
化合物番号	$\text{-X}^1\text{-X}^2\text{-X}^3$	A	R
I-7F-31a	31	7F	CO_2H
I-7F-47a	47	7F	CO_2H
I-7F-88a	88	7F	CO_2H
I-7F-143a	143	7F	CO_2H
I-7G-1a	1	7G	CO_2H
I-7G-88a	88	7G	CO_2H
I-7G-126a	126	7G	CO_2H
I-7H-1a	1	7H	CO_2H
I-7I-1a	1	7I	CO_2H
I-7I-1b	1	7I	CO_2Me
I-7I-1c	1	7I	CONH_2
I-7I-1e	1	7I	CONHSO_2Me
I-7I-31a	31	7I	CO_2H
I-7I-47a	47	7I	CO_2H
I-7I-55a	55	7I	CO_2H
I-7I-59a	59	7I	CO_2H
I-7I-80a	80	7I	CO_2H
I-7I-88a	88	7I	CO_2H
I-7I-93a	93	7I	CO_2H
I-7I-126a	126	7I	CO_2H
I-7I-143a	143	7I	CO_2H
I-7I-197a	197	7I	CO_2H
I-7I-270a	270	7I	CO_2H
I-7I-307a	307	7I	CO_2H
I-7I-327a	327	7I	CO_2H
I-7I-332a	332	7I	CO_2H
I-7I-343a	343	7I	CO_2H
I-7I-385a	385	7I	CO_2H
I-7I-389a	389	7I	CO_2H
I-7I-391a	391	7I	CO_2H
I-7J-1a	1	7J	CO_2H
I-7J-31a	31	7J	CO_2H
I-7K-1a	1	7K	CO_2H
I-7K-47a	47	7K	CO_2H
I-7K-59a	59	7K	CO_2H
I-7K-143a	143	7K	CO_2H
I-7L-1a	1	7L	CO_2H
I-7M-1a	1	7M	CO_2H
I-7M-1b	1	7M	CO_2Me
I-7M-1c	1	7M	CONH_2
I-7M-1e	1	7M	CONHSO_2Me
I-7M-31a	31	7M	CO_2H
I-7M-40a	40	7M	CO_2H

表 4



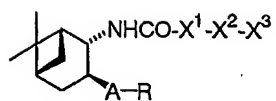
化合物番号	-X ¹ -X ² -X ³	A	R
I-7M-43a	43	7M	CO ₂ H
I-7M-47a	47	7M	CO ₂ H
I-7M-55a	55	7M	CO ₂ H
I-7M-59a	59	7M	CO ₂ H
I-7M-80a	80	7M	CO ₂ H
I-7M-88a	88	7M	CO ₂ H
I-7M-88e	88	7M	CONHSO ₂ Me
I-7M-88h	88	7M	CH ₂ OH
I-7M-88i	88	7M	CH ₂ OMe
I-7M-104a	104	7M	CO ₂ H
I-7M-126a	126	7M	CO ₂ H
I-7M-143a	143	7M	CO ₂ H
I-7M-197a	197	7M	CO ₂ H
I-7M-270a	270	7M	CO ₂ H
I-7M-307a	307	7M	CO ₂ H
I-7M-315a	315	7M	CO ₂ H
I-7M-316a	316	7M	CO ₂ H
I-7M-317a	317	7M	CO ₂ H
I-7M-318a	318	7M	CO ₂ H
I-7M-327a	327	7M	CO ₂ H
I-7M-329a	329	7M	CO ₂ H
I-7M-330a	330	7M	CO ₂ H
I-7M-331a	331	7M	CO ₂ H
I-7M-332a	332	7M	CO ₂ H
I-7M-333a	333	7M	CO ₂ H
I-7M-334a	334	7M	CO ₂ H
I-7M-336a	336	7M	CO ₂ H
I-7M-337a	337	7M	CO ₂ H
I-7M-342a	342	7M	CO ₂ H
I-7M-343a	343	7M	CO ₂ H
I-7M-385a	385	7M	CO ₂ H
I-7M-389a	389	7M	CO ₂ H
I-7M-390a	390	7M	CO ₂ H
I-7M-391a	391	7M	CO ₂ H
I-7M-392a	392	7M	CO ₂ H
I-7M-393a	393	7M	CO ₂ H
I-7M-396a	396	7M	CO ₂ H
I-7M-412a	412	7M	CO ₂ H
I-7M-424a	424	7M	CO ₂ H
I-7M-446a	446	7M	CO ₂ H
I-7M-447a	447	7M	CO ₂ H
I-7M-448a	448	7M	CO ₂ H
I-7N-1a	1	7N	CO ₂ H

表 5



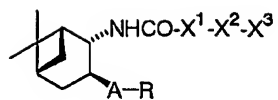
化合物番号	$\text{-X}^1\text{-X}^2\text{-X}^3$	A	R
I-7N-1b	1	7N	CO_2Me
I-7N-55a	55	7N	CO_2H
I-7N-88a	88	7N	CO_2H
I-7N-143a	143	7N	CO_2H
I-7O-1a	1	7O	CO_2H
I-7P-1a	1	7P	CO_2H
I-7P-1e	1	7P	CONHSO_2Me
I-7Q-1a	1	7Q	CO_2H
I-7R-1a	1	7R	CO_2H
I-7R-59a	59	7R	CO_2H
I-7R-88a	88	7R	CO_2H
I-7R-270a	270	7R	CO_2H
I-7R-307a	307	7R	CO_2H
I-7S-1a	1	7S	CO_2H
I-7T-1a	1	7T	CO_2H
I-8A-1a	1	8A	CO_2H
I-8A-47a	47	8A	CO_2H
I-8A-88a	88	8A	CO_2H
I-8B-1a	1	8B	CO_2H
I-8B-47a	47	8B	CO_2H
I-8B-88a	88	8B	CO_2H
I-8C-1a	1	8C	CO_2H
I-8C-88a	88	8C	CO_2H
I-9A-1a	1	9A	CO_2H
I-9A-47a	47	9A	CO_2H
I-9A-88a	88	9A	CO_2H
I-9B-1a	1	9B	CO_2H
I-9B-47a	47	9B	CO_2H
I-9B-88a	88	9B	CO_2H

表 6



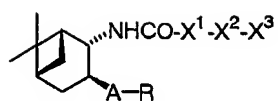
化合物番号	$\text{-X}^1\text{-X}^2\text{-X}^3$	A	R
II-4A-55a	55	4A	CO_2H
II-4B-55a	55	4B	CO_2H
II-4C-55a	55	4C	CO_2H
II-4D-55a	55	4D	CO_2H
II-4E-55a	55	4E	CO_2H
II-4F-55a	55	4F	CO_2H
II-5A-1a	1	5A	CO_2H
II-5A-1b	1	5A	CO_2Me
II-5A-31a	31	5A	CO_2H
II-5A-47a	47	5A	CO_2H
II-5A-55a	55	5A	CO_2H
II-5A-55c	55	5A	CONH_2
II-5A-55g	55	5A	5-tetrazolyl
II-5A-59a	59	5A	CO_2H
II-5A-80a	80	5A	CO_2H
II-5A-88a	88	5A	CO_2H
II-5A-88b	88	5A	CO_2Me
II-5A-104a	104	5A	CO_2H
II-5A-126a	126	5A	CO_2H
II-5A-143a	143	5A	CO_2H
II-5A-197a	197	5A	CO_2H

表 7



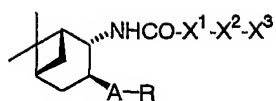
化合物番号	-X ¹ -X ² -X ³	A	R
II-5B-1a	1	5B	CO ₂ H
II-5B-47a	47	5B	CO ₂ H
II-5B-55a	55	5B	CO ₂ H
II-5C-1a	1	5C	CO ₂ H
II-5C-1b	1	5C	CO ₂ Me
II-5C-55a	55	5C	CO ₂ H
II-5C-88a	88	5C	CO ₂ H
II-5D-1a	1	5D	CO ₂ H
II-5E-1a	1	5E	CO ₂ H
II-5E-55a	55	5E	CO ₂ H
II-5F-31a	31	5F	CO ₂ H
II-5F-47a	47	5F	CO ₂ H
II-5F-55a	55	5F	CO ₂ H
II-5F-88a	88	5F	CO ₂ H
II-5G-47a	47	5G	CO ₂ H
II-6A-1a	1	6A	CO ₂ H
II-6A-31a	31	6A	CO ₂ H
II-6A-55a	55	6A	CO ₂ H
II-6A-88a	88	6A	CO ₂ H
II-6B-1a	1	6B	CO ₂ H
II-6B-31a	31	6B	CO ₂ H
II-6B-55a	55	6B	CO ₂ H
II-6B-88a	88	6B	CO ₂ H

表 8



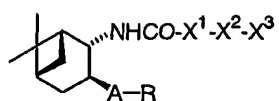
化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
II-6C-31a	31	6C	CO ₂ H
II-6D-1a	1	6D	CO ₂ H
II-6E-1a	1	6E	CO ₂ H
II-6E-59a	59	6E	CO ₂ H
II-6F-1a	1	6F	CO ₂ H
II-6G-1a	1	6G	CO ₂ H
II-7A-1a	1	7A	CO ₂ H
II-7A-1b	1	7A	CO ₂ Me
II-7A-1c	1	7A	CONH ₂
II-7A-31a	31	7A	CO ₂ H
II-7A-47a	47	7A	CO ₂ H
II-7A-55a	55	7A	CO ₂ H
II-7A-55e	55	7A	CONHSO ₂ Me
II-7A-55g	55	7A	5-tetrazolyl
II-7A-59a	59	7A	CO ₂ H
II-7A-80a	80	7A	CO ₂ H
II-7A-88a	88	7A	CO ₂ H
II-7A-88e	88	7A	CONHSO ₂ Me
II-7A-88h	88	7A	CH ₂ OH
II-7A-88i	88	7A	CH ₂ OMe
II-7A-104a	104	7A	CO ₂ H
II-7A-143a	143	7A	CO ₂ H
II-7A-197a	197	7A	CO ₂ H
II-7A-315a	315	7A	CO ₂ H
II-7A-316a	316	7A	CO ₂ H
II-7B-55a	55	7B	CO ₂ H
II-7C-1a	1	7C	CO ₂ H
II-7D-1a	1	7D	CO ₂ H
II-7E-1c	1	7E	CONH ₂
II-7E-1d	1	7E	CONHMe
II-7E-1e	1	7E	CONHSO ₂ Me
II-7E-1f	1	7E	CON(Me)SO ₂ Me
II-7E-1g	1	7E	5-tetrazolyl
II-7E-1h	1	7E	CH ₂ OH
II-7E-1i	1	7E	CH ₂ OMe
II-7E-47c	47	7E	CONH ₂
II-7E-55c	55	7E	CONH ₂
II-7E-55e	55	7E	CONHSO ₂ Me
II-7E-55g	55	7E	5-tetrazolyl
II-7E-88e	88	7E	CONHSO ₂ Me
II-7E-88h	88	7E	CH ₂ OH
II-7E-88i	88	7E	CH ₂ OMe
II-7F-1a	1	7F	CO ₂ H

表 9



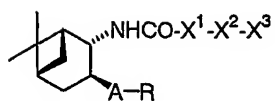
化合物番号	$-X^1-X^2-X^3$	A	R
II-7F-47a	47	7F	CO_2H
II-7F-55a	55	7F	CO_2H
II-7F-88a	88	7F	CO_2H
II-7F-143a	143	7F	CO_2H
II-7G-1a	1	7G	CO_2H
II-7H-1a	1	7H	CO_2H
II-7I-1a	1	7I	CO_2H
II-7I-1b	1	7I	CO_2Me
II-7I-1c	1	7I	$CONH_2$
II-7I-1e	1	7I	$CONHSO_2Me$
II-7I-31a	31	7I	CO_2H
II-7I-47a	47	7I	CO_2H
II-7I-55a	55	7I	CO_2H
II-7I-55b	55	7I	CO_2Me
II-7I-59a	59	7I	CO_2H
II-7I-80a	80	7I	CO_2H
II-7I-88a	88	7I	CO_2H
II-7I-104a	104	7I	CO_2H
II-7I-126a	126	7I	CO_2H
II-7I-197a	197	7I	CO_2H
II-7I-239a	239	7I	CO_2H
II-7I-270a	270	7I	CO_2H
II-7I-327a	327	7I	CO_2H
II-7I-332a	332	7I	CO_2H
II-7I-343a	343	7I	CO_2H
II-7I-389a	389	7I	CO_2H
II-7I-391a	391	7I	CO_2H
II-7J-1a	1	7J	CO_2H
II-7J-55a	55	7J	CO_2H
II-7K-1a	1	7K	CO_2H
II-7K-47a	47	7K	CO_2H
II-7K-55a	55	7K	CO_2H
II-7K-59a	59	7K	CO_2H
II-7K-143a	143	7K	CO_2H
II-7L-1a	1	7L	CO_2H
II-7L-55a	55	7L	CO_2H
II-7M-1a	1	7M	CO_2H
II-7M-1b	1	7M	CO_2Me
II-7M-1c	1	7M	$CONH_2$
II-7M-1e	1	7M	$CONHSO_2Me$
II-7M-1k	1	7M	$CONHSO_2Ph$
II-7M-31a	31	7M	CO_2H
II-7M-40a	40	7M	CO_2H

表 1 0



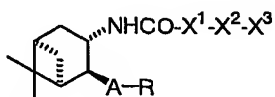
化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
II-7M-43a	43	7M	CO₂H
II-7M-47a	47	7M	CO₂H
II-7M-55a	55	7M	CO₂H
II-7M-59a	59	7M	CO₂H
II-7M-80a	80	7M	CO₂H
II-7M-88a	88	7M	CO₂H
II-7M-88e	88	7M	CONHSO₂Me
II-7M-88h	88	7M	CH₂OH
II-7M-88i	88	7M	CH₂OMe
II-7M-104a	104	7M	CO₂H
II-7M-126a	126	7M	CO₂H
II-7M-143a	143	7M	CO₂H
II-7M-197a	197	7M	CO₂H
II-7M-239a	239	7M	CO₂H
II-7M-270a	270	7M	CO₂H
II-7M-307a	307	7M	CO₂H
II-7M-327a	327	7M	CO₂H
II-7M-329a	329	7M	CO₂H
II-7M-330a	330	7M	CO₂H
II-7M-331a	331	7M	CO₂H
II-7M-332a	332	7M	CO₂H
II-7M-333a	333	7M	CO₂H
II-7M-334a	334	7M	CO₂H
II-7M-336a	336	7M	CO₂H
II-7M-343a	343	7M	CO₂H
II-7M-385a	385	7M	CO₂H
II-7M-389a	389	7M	CO₂H
II-7M-390a	390	7M	CO₂H
II-7M-391a	391	7M	CO₂H
II-7M-392a	392	7M	CO₂H
II-7M-393a	393	7M	CO₂H
II-7N-1a	1	7N	CO₂H
II-7N-55a	55	7N	CO₂H
II-7N-88a	88	7N	CO₂H
II-7N-143a	143	7N	CO₂H
II-7O-55a	55	7O	CO₂H
II-7P-55a	55	7P	CO₂H
II-7P-55e	55	7P	CONHSO₂Me
II-7P-55j	55	7P	CONHSO₂CF₃
II-7Q-1a	1	7Q	CO₂H
II-7Q-55a	55	7Q	CO₂H
II-7R-55a	55	7R	CO₂H
II-7R-88a	88	7R	CO₂H

表 1 1



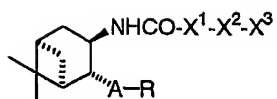
化合物番号	$\text{-X}^1\text{-X}^2\text{-X}^3$	A	R
II-7R-270a	270	7R	CO_2H
II-7S-1a	1	7S	CO_2H
II-7S-47a	47	7S	CO_2H
II-7S-55a	55	7S	CO_2H
II-7T-55a	55	7T	CO_2H
II-7U-31a	31	7U	CO_2H
II-7U-55a	55	7U	CO_2H
II-7U-88a	88	7U	CO_2H
II-7V-55a	55	7V	CO_2H
II-8A-1a	1	8A	CO_2H
II-8A-47a	47	8A	CO_2H
II-8A-88a	88	8A	CO_2H
II-8B-1a	1	8B	CO_2H
II-8B-47a	47	8B	CO_2H
II-8B-88a	88	8B	CO_2H
II-8C-55a	55	8C	CO_2H
II-8C-88a	88	8C	CO_2H
II-9A-1a	1	9A	CO_2H
II-9A-47a	47	9A	CO_2H
II-9A-88a	88	9A	CO_2H
II-9B-1a	1	9B	CO_2H
II-9B-47a	47	9B	CO_2H
II-9B-88a	88	9B	CO_2H

表 1 2



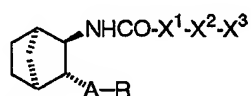
化合物番号	$\text{-X}^1\text{-X}^2\text{-X}^3$	A	R
III-5A-1a	1	5A	CO_2H
III-5A-47a	47	5A	CO_2H
III-5A-55a	55	5A	CO_2H
III-5A-80a	80	5A	CO_2H
III-7A-1a	1	7A	CO_2H
III-7A-47a	47	7A	CO_2H
III-7A-55a	55	7A	CO_2H
III-7A-80a	80	7A	CO_2H

表 1 3



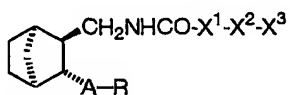
化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
IV-5A-1a	1	5A	CO₂H
IV-5A-47a	47	5A	CO₂H
IV-7A-1a	1	7A	CO₂H
IV-7A-47a	47	7A	CO₂H

表 1 4



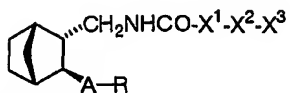
化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
V-5A-88a	88	5A	CO₂H
V-7A-88a	88	7A	CO₂H

表 1 5



化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
VI-6A-1a	1	6A	CO₂H
VI-6A-31a	31	6A	CO₂H
VI-6A-40a	40	6A	CO₂H
VI-6A-47a	47	6A	CO₂H
VI-6A-55a	55	6A	CO₂H
VI-6A-80a	80	6A	CO₂H
VI-6A-88a	88	6A	CO₂H
VI-6A-104a	104	6A	CO₂H
VI-6A-122a	122	6A	CO₂H
VI-6A-123a	123	6A	CO₂H
VI-6A-124a	124	6A	CO₂H
VI-6A-133a	133	6A	CO₂H

表 1 6



化合物番号	-X¹-X²-X³	A	R
VII-6A-1a	1	6A	CO₂H
VII-6A-47a	47	6A	CO₂H
VII-6A-88a	88	6A	CO₂H

表 1 7

化合物番号	物性値
I-4B-1a	¹ H-NMR (CD ₃ OD) δ 1.24-2.33 (11H, m), 2.46 (1H, m), 3.69-3.76 (2H, m), 6.11 (1H, dt, J = 7.8 and 33.3 Hz), 6.36 (2H, m), 7.23 (2H, m), 7.71 (2H, m), 8.54 (1H, br); IR (CHCl ₃) 3442, 2877, 1741, 1657, 1529, 1504, 1456, 1383, 1167, 1076, 1057, 1036 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +37.7±0.7° (c=1.05, MeOH)
I-4E-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.26-1.76(7H, m), 2.10 (1H, m), 2.47 (1H, m), 3.35 (1H, dd, J = 8.4 and 9.0 Hz), 3.58 (1H, dd, J = 6.3 and 8.4 Hz), 3.98 (1H, d, J = 16.2 Hz), 4.08 (1H, m), 4.13 (1H, d, J = 16.2 Hz), 6.27 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.34 (2H, d, J = 4.8 Hz), 7.15 (2H, d, J = 4.8 Hz), 7.37 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.58 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3440, 2958, 2879, 1753, 1734, 1655, 1533, 1508, 1477, 1456, 1427, 1383, 1315, 1167, 1122, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +41.7±0.8° (c=1.00, CHCl ₃) 元素分析 (C ₁₉ H ₂₂ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 50.79; H, 5.20; N, 6.23; S, 14.27 実測値 (%): C, 50.76; H, 5.00; N, 6.26; S, 14.09
I-4F-1a	mp 126-128 °C; ¹ H-NMR (CD ₃ OD) δ 1.26-1.66 (8H, m), 2.03 (1H, m), 2.48 (1H, m), 2.57 (1H, m), 3.76 (1H, m), 5.69 (1H, dt, J = 8.1 and 21.3 Hz), 6.36 (2H, m), 7.23 (2H, m), 7.72 (2H, m), 8.53 (1H, d, J = 5.4 Hz); IR (CHCl ₃) 3417, 3322, 2958, 2877, 1730, 1653, 1535, 1508, 1456, 1427, 1379, 1302, 1167, 1128, 1057, 1036 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +68.3±1.0° (c=1.04, MeOH) 元素分析 (C ₂₀ H ₂₁ FN ₂ O ₅ S ₂ ·0.9H ₂ O) 計算値 (%): C, 51.52; H, 4.90; N, 5.98; F, 4.05; S, 13.68 実測値 (%): C, 51.46; H, 4.62; N, 5.72; F, 3.72; S, 12.93
I-5A-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.02 (1H, m), 1.23-1.44 (8H, m), 1.54-1.65 (4H, m), 2.00 (1H, m), 2.29-2.36 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.80 (1H, m), 6.17 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.15-7.16 (2H, m), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3442, 1709, 1658, 1529, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁷ +48.7±0.9° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C ₂₁ H ₂₆ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%): C, 55.98; H, 5.82; N, 6.22; S, 14.23 実測値 (%): C, 56.10; H, 5.81; N, 6.08; S, 13.77
I-5A-31a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.95 (1H, m), 1.16-1.70 (12H, m), 1.97 (1H, m), 2.32 (2H, t, J = 7.2Hz), 2.48 (1H, m), 3.81 (1H, m), 4.14 (2H, s), 5.83 (1H, d, J = 6.6 Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.3 Hz), 7.21-7.37 (6H, m); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 3427, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +46.9±0.9° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₂₉ NO ₃ S·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 68.54; H, 7.19; N, 3.33; S, 7.62 実測値 (%): C, 68.62; H, 7.03; N, 3.47; S, 7.54

表 1 8

化合物番号	物性値
I-5A-47a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.03 (1H, m), 1.18-1.70 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.32 (2H, dt, $J = 8.1, 2.1$ Hz), 2.50 (1H, m), 3.81 (1H, m), 6.19 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 5.1, 3.9$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.61 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz), 7.75 (1H, dd, $J = 3.9, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3512, 3442, 3375, 2679, 1709, 1655, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1095, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +48.6 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 53.53; H, 5.43; N, 2.97; S, 20.41 実測値 (%): C, 53.56; H, 5.32; N, 2.92; S, 20.17
I-5A-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.02 (1H, m), 1.25-1.48 (8H, m), 1.55-1.66 (4H, m), 2.01 (1H, m), 2.32 (2H, dt, $J = 2.1, 7.5$ Hz), 2.38 (3H, s), 2.50 (1H, br s), 3.80 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.07 (1H, br d, $J = 5.7$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.35 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3514, 3442, 3149, 3101, 1709, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +47.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 56.87; H, 6.07; N, 6.03; S, 13.80 実測値 (%): C, 56.59; H, 6.06; N, 5.91; S, 13.52
I-5A-59a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.97 (1H, m), 1.16-1.68 (12H, m), 1.98 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 2.31 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.47 (1H, m), 3.79 (1H, m), 5.86 (1H, d, $J = 4.5$ Hz), 7.01 (1H, dd, $J = 5.4, 3.6$ Hz), 7.04 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J = 3.6, 1.2$ Hz), 7.31 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.42 (1H, dd, $J = 5.4, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3444, 3425, 2671, 1709, 1645, 1531, 1498, 1421 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.0} +49.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{25}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.66; H, 5.81; N, 3.20; S, 21.99 実測値 (%): C, 57.47; H, 5.81; N, 3.23; S, 22.21
I-5A-59b	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.96 (1H, m), 1.16-1.66 (12H, m), 1.98 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 2.27 (2H, dt, $J = 7.2, 1.8$ Hz), 2.49 (1H, m), 3.62 (3H, s), 3.77 (1H, m), 5.85 (1H, d, $J = 6.9$ Hz), 7.01 (1H, dd, $J = 5.4, 3.6$ Hz), 7.04 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.29 (1H, dd, $J = 3.6, 1.2$ Hz), 7.31 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.43 (1H, dd, $J = 5.4, 1.2$ Hz)
I-5A-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.96 (1H, m), 1.16-1.70 (12H, m), 1.99 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 2.32 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.50 (1H, m), 3.82 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.85 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 5.1, 1.5$ Hz), 7.05 (1H, m), 7.28 (1H, dd, $J = 5.1, 3.0$ Hz), 7.35 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3446, 3427, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +44.9 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.00; H, 6.54; N, 3.34; S, 15.29 実測値 (%): C, 63.06; H, 6.53; N, 3.43; S, 15.01

表 1 9

化合物番号	物性値
I-5A-104a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.18-1.70 (12H, m), 1.99 (1H, m), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.50 (1H, m), 3.82 (1H, m), 4.10 (2H, s), 5.88 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.70 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.95 (1H, dd, J = 5.4, 3.6 Hz), 7.04 (1H, dd, J = 3.6, 1.2 Hz), 7.28 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.36 (1H, dd, J = 5.4, 1.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 2669, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +44.5±1.3° (c=0.670, MeOH) 元素分析 (C ₂₂ H ₂₇ NO ₃ S ₃ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.30; H, 6.09; N, 3.09; S, 21.22 実測値 (%): C, 58.34; H, 6.09; N, 3.25; S, 21.10
I-5A-143a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.01 (1H, m), 1.16-1.72 (12H, m), 2.00 (1H, m), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.57 (1H, m), 3.93 (1H, m), 4.24 (2H, s), 6.03 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.18-7.34 (6H, m), 7.42 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.80 (1H, s), 8.17 (1H, d, J = 7.8 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3438, 1709, 1651, 1516, 1495 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +41.4±0.8° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C ₂₈ H ₃₁ NO ₃ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 72.01; H, 6.82; N, 3.00; S, 6.87 実測値 (%): C, 72.05; H, 6.81; N, 3.02; S, 6.75
I-5A-197a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, m), 1.18-1.68 (12H, m), 1.97 (1H, d, J = 3.9 Hz), 2.32 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.48 (1H, m), 3.22 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.80 (1H, m), 4.07 (2H, s), 4.57 (2H, t, J = 8.7 Hz), 5.83 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.79 (1H, t, J = 7.5 Hz), 6.81 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.97 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.09 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3446, 3427, 2679, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +14.7±0.5° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ NO ₄ S·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 67.24; H, 6.99; N, 3.01; S, 6.90 実測値 (%): C, 67.14; H, 6.85; N, 3.03; S, 6.64
I-5B-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.08-1.70 (7H, m), 2.04 (1H, m), 2.10-2.18 (2H, m), 2.53 (1H, brs), 3.14 (1H, d, J = 6.0 Hz), 3.81 (1H, m), 5.52-5.67 (2H, m), 6.25 (1H, d, J = 6.9 Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.14-7.16 (2H, m), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.54 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3512, 3440, 1712, 1658, 1531, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁷ +61.4±1.0° (c=1.008, MeOH) 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.56; H, 5.46; N, 6.17; S, 14.13 実測値 (%): C, 55.47; H, 5.42; N, 6.54; S, 14.26
I-5C-1a	mp 149-152 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.07 (1H, m), 1.24-1.32 (2H, m), 1.41-1.48 (2H, m), 1.53-1.69 (4H, m), 2.01 (1H, m), 2.23-2.30 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.87 (1H, m), 5.78 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.15 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.02 (1H, dt, J = 15.6 and 7.2 Hz), 7.15-7.17 (2H, m), 7.37 and 7.56 (each 1H, each d, each J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3440, 2679, 1695, 1655, 1529, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +38.7±0.8° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.78; H, 5.44; N, 6.20; S, 14.18 実測値 (%): C, 55.70; H, 5.36; N, 6.20; S, 14.08

表 2 0

化合物番号	物性値
I-5C-31a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.22-1.29 (2H, m), 1.42-1.49 (2H, m), 1.53-1.69 (4H, m), 1.99 (1H, m), 2.18-2.33 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.88 (1H, m), 4.14 (2H, s), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 5.85 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.78 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.03 (1H, dt, J = 6.9 and 15.6 Hz), 7.23-7.33 (5H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3446, 3427, 2679, 1695, 1649, 1543, 1506, 1456, 1308, 1282 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +41.2±0.8° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₂₇ NO ₃ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 69.77; H, 6.68; N, 3.39; S, 7.76 実測値 (%): C, 69.72; H, 6.55; N, 3.40; S, 7.65
I-5C-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.09 (1H, m), 1.25-1.31 (2H, m), 1.42-1.47 (2H, m), 1.56-1.64 (4H, m), 2.00 (1H, m), 2.24-2.31 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.88 (1H, m), 5.78 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.25 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.02 (1H, dt, J = 15.6 and 6.8 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 3.6 and 4.8 Hz), 7.42 and 7.61 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.5 and 4.8 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 1.5 and 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3440, 3373, 2681, 1695, 1653, 1529, 1504, 1335, 1402, 1153, 1095, 1020 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +39.1±0.8° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C ₂₁ H ₃₃ NO ₅ S ₃ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 53.55; H, 5.05; N, 2.97; S, 20.42 実測値 (%): C, 53.58; H, 4.97; N, 3.04; S, 20.17
I-5C-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.00 (1H, m), 1.23-1.30 (2H, m), 1.43-1.48 (2H, m), 1.53-1.69 (4H, m), 2.00 (1H, m), 2.19-2.33 (2H, m), 2.50 (1H, brs), 3.88 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.79 (1H, dt, J = 15.6 and 1.5 Hz), 5.90 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.95-7.08 (3H, m), 7.28 (1H, dd, J = 2.7 and 4.8 Hz), 7.36 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3446, 3427, 2679, 1695, 1649, 1543, 1506, 1458, 1284 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +39.9±0.8° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₂₇ NO ₃ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 63.04; H, 6.11; N, 3.34; S, 15.30 実測値 (%): C, 63.12; H, 5.96; N, 3.44; S, 15.22
I-5D-1a	mp 150-152 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.32-1.66 (6H, m), 1.96 (1H, m), 2.12-2.46 (5H, m), 2.61 (1H, br s), 3.87 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.41 (1H, dd, J = 9.6, 10.5 Hz), 6.33 (2H, t, J = 2.4 Hz), 6.68 (1H, br d, J = 7.2 Hz), 7.15 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.44 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.48 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3510, 3390, 3145, 3101, 2673, 1709, 1655, 1531, 1506, 1456, 1381, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +9.2±0.5° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%): C, 56.23; H, 5.39; N, 6.25; S, 14.30 実測値 (%): C, 56.20; H, 5.44; N, 6.23; S, 14.23

表 2 1

化合物番号	物性値
I-5E-1a	mp 155-159 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.18-1.82 (9H, m), 2.00 (1H, m), 2.61 (1H, m), 3.50-3.59 (2H, m), 3.79 (1H, m), 3.99 and 4.10 (each 1H, Abq, J = 17.1 Hz), 5.54-5.70 (2H, m), 6.32-6.34 (2H, m), 6.47 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.14-7.17 (2H, m), 7.39 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.54 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3423, 1764, 1730, 1655, 1531, 1506, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁸ +28.9±0.7° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C ₂₀ H ₂₆ N ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%): C, 53.08; H, 5.35; N, 6.19; S, 14.17 実測値 (%): C, 53.44; H, 5.62; N, 6.00; S, 13.70
I-6A-1a	mp 109-111 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.02 (1H, m), 1.24-1.56 (14H, m), 1.98 (1H, brs), 2.29 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.48 (1H, brs), 3.79 (1H, m), 6.28 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.33 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.15 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.38 and 7.55 (each 1H, each d, each J = 4.2 Hz); IR (KBr) 3352, 1709, 1624, 1541, 1512, 1456, 1377, 1192, 1167, 1057, 1036 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.5} +47.7±0.9° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C ₂₂ H ₂₈ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.44; H, 6.11; N, 5.98; S, 13.70 実測値 (%): C, 56.50; H, 6.11; N, 6.18; S, 13.51
I-6B-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.08 (1H, m), 1.21-1.31 (2H, m), 1.40-1.45 (2H, m), 1.58-1.66 (2H, m), 2.03-2.19 (3H, m), 2.32-2.46 (4H, m), 2.52 (1H, brs), 3.80 (1H, m), 5.33-5.45 (2H, m), 6.24 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.32-6.34 (2H, m), 7.15-7.16 (2H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3440, 1711, 1657, 1531, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.5} +69.8±1.1° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.68; H, 5.71; N, 6.01; S, 13.76 実測値 (%): C, 56.67; H, 5.70; N, 6.14; S, 13.89
I-6B-31a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.04 (1H, m), 1.17-1.28 (2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.55-1.66 (2H, m), 2.00 (1H, m), 2.04-2.24 (2H, m), 2.31-2.44 (4H, m), 2.51 (1H, brs), 3.82 (1H, m), 4.13 (2H, s), 5.32-5.44 (2H, m), 5.96 (1H, d, J = 6.6 Hz), 6.76 (1H, dt, J = 3.6 and 0.9 Hz), 7.22-7.35 (5H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3444, 3427, 2671, 1711, 1643, 1545, 1506, 1454, 1309, 1279 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +67.7±1.1° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C ₂₅ H ₂₉ NO ₃ S) 計算値 (%): C, 70.89; H, 6.90; N, 3.31; S, 7.57 実測値 (%): C, 70.67; H, 6.95; N, 3.36; S, 7.42
I-6D-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.26-1.34 (2H, m), 1.43-1.48 (2H, m), 1.55-1.76 (4H, m), 1.96-2.13 (4H, m), 2.32 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.59 (1H, br s), 3.92 (1H, m), 5.28-5.44 (2H, m), 6.33 (2H, t, J = 2.1 Hz), 6.69 (1H, br d, J = 6.6 Hz), 7.15 (2H, t, J = 2.1 Hz), 7.39 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.53 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3512, 3368, 1706, 1654, 1532, 1506, 1455, 1382, 1212, 1132, 1106, 1075, 1016 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%): C, 57.12; H, 5.67; N, 6.06; S, 13.86 実測値 (%): C, 56.91; H, 5.71; N, 6.18; S, 13.75

表 2 2

化合物番号	物性値
I-7A-1a	mp 114-117 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.05 (1H, m), 1.18-1.70 (16H, m), 2.00 (1H, m), 2.32 (2H, t, J = 6.9 Hz), 2.49 (1H, m), 3.80 (1H, m), 6.05 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.18 (2H, m), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.57 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 1708, 1657, 1529, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +45.9±0.9° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%): C, 57.72; H, 6.32; N, 5.85; S, 13.40 実測値 (%): C, 57.56; H, 6.44; N, 5.82; S, 13.11
I-7A-1e	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.01 (1H, m), 1.29-1.67 (16H, m), 1.99 (1H, m), 2.30 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.45 (1H, m), 3.28 (3H, s), 3.84 (1H, m), 6.14 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.34 (2H, d, J = 4.5 Hz), 7.16 (2H, d, J = 4.5 Hz), 7.40 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3386, 2954, 2929, 2877, 2858, 1720, 1651, 1531, 1506, 1456, 1425, 1398, 1385, 1342, 1167, 1076, 1067, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +38.5±0.8° (c=1.01, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₃ N ₃ O ₆ S ₃ ·0.8MeOH) 計算値 (%): C, 51.24; H, 6.28; N, 7.23; S, 16.55 実測値 (%): C, 51.59; H, 6.17; N, 7.40; S, 16.22
I-7A-1h	mp 134-136 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.97 (1H, m), 1.28-1.69 (18H, m), 2.01 (1H, m), 2.49 (1H, brs), 3.61 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.81 (1H, m), 6.05 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.33-6.35 (2H, m), 7.16-7.17 (2H, m), 7.35 and 7.57 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3357, 3244, 1621, 1554, 1371, 1186, 1169, 1061, 1038 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +47.8±0.9° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₃₂ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 59.27; H, 7.02; N, 5.81; S, 13.30 実測値 (%): C, 59.53; H, 7.09; N, 5.92; S, 13.29
I-7A-1i	mp 82-84 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.95 (1H, m), 1.26-1.65 (18H, m), 2.01 (1H, m), 2.49 (1H, brs), 3.32 (3H, s), 3.34 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.80 (1H, m), 5.97 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.16-7.17 (2H, m), 7.33 and 7.58 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 1658, 1529, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1113, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +43.9±0.8° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₄ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 60.22; H, 7.16; N, 5.85; S, 13.40 実測値 (%): C, 60.27; H, 7.14; N, 5.79; S, 13.29
I-7A-31a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, m), 1.18-1.66 (16H, m), 1.96 (1H, m), 2.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.48 (1H, m), 3.81 (1H, m), 4.13 (2H, s), 5.83 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.21-7.36 (6H, m); IR (CHCl ₃) 3516, 3446, 3427, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +41.0±0.8° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₃ NO ₃ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 70.46; H, 7.60; N, 3.16; S, 7.23 実測値 (%): C, 70.43; H, 7.66; N, 3.21; S, 7.07

表 2 3

化合物番号	物性値
I-7A-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.98 (1H, m), 1.16-1.70 (16H, m), 1.99 (1H, m), 2.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.49 (1H, m), 3.80 (1H, m), 6.05 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 4.8, 3.6 Hz), 7.39 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.64 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.69 (1H, dd, J = 4.8, 1.2 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 3.6, 1.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3442, 3375, 2677, 1709, 1655, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1095, 1022 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +45.7±0.9° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₉ NO ₅ S ₃ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.33; H, 5.94; N, 2.80; S, 19.26 実測値 (%): C, 55.42; H, 6.04; N, 2.86; S, 19.03
I-7A-47i	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, m), 1.26-1.35 (11H, m), 1.40-1.46 (2H, m), 1.51-1.67 (5H, m), 2.01 (1H, m), 2.50 (1H, brs), 3.32 (3H, s), 3.34 (2H, t, J = 6.9 Hz), 3.80 (1H, m), 6.03 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 3.9 and 4.8 Hz), 7.38 and 7.65 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.5 and 4.8 Hz), 7.76 (1H, dd, J = 1.5 and 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 1657, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1113, 1095, 1020 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +43.7±0.8° (c=1.008, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₃ NO ₄ S ₃ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.94; H, 6.73; N, 2.82; S, 19.34 実測値 (%): C, 57.81; H, 6.68; N, 2.90; S, 19.42
I-7A-59a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.93 (1H, m), 1.16-1.68 (16H, m), 1.98 (1H, d, J = 3.6 Hz), 2.31 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.47 (1H, m), 3.78 (1H, m), 5.87 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.00 (1H, dd, J = 5.7, 3.9 Hz), 7.04 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.28 (1H, dd, J = 3.9, 1.2 Hz), 7.31 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.42 (1H, dd, J = 5.7, 1.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3444, 3427, 2671, 1709, 1645, 1529, 1498, 1421 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +41.2±0.8° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₉ NO ₃ S ₃) 計算値 (%): C, 59.58; H, 6.30; N, 3.02; S, 20.75 実測値 (%): C, 59.70; H, 6.27; N, 3.03; S, 20.56
I-7A-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.93 (1H, m), 1.16-1.68 (16H, m), 1.98 (1H, d, J = 3.6 Hz), 2.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.49 (1H, m), 3.81 (1H, m), 4.15 (2H, s), 5.86 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 4.8, 1.2 Hz), 7.05 (1H, dd, J = 3.0, 1.2 Hz), 7.28 (1H, dd, J = 4.8, 3.0 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3446, 3427, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +40.2±0.8° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₁ NO ₃ S ₂ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 64.42; H, 7.03; N, 3.13; S, 14.33 実測値 (%): C, 64.52; H, 7.00; N, 3.18; S, 14.04
I-7A-88h	mp 92-93 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.94 (1H, m), 1.20-1.34 (11H, m), 1.42-1.47 (2H, m), 1.48-1.63 (5H, m), 1.98 (1H, m), 2.49 (1H, brs), 3.61 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.83 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.86 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.97 (1H, dd, J = 1.2 and 4.8 Hz), 7.06 (1H, m), 7.29 (1H, dd, J = 3.0 and 4.8 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (Nujol) 3315, 3259, 1599, 1549, 1527, 1317 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +45.0±0.9° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₃ NO ₂ S ₂) 計算値 (%): C, 66.78; H, 7.71; N, 3.24; S, 14.86 実測値 (%): C, 66.85; H, 7.71; N, 3.37; S, 14.57

表 2 4

化合物番号	物性値
I-7A-88i	mp 47-48 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, m), 1.23-1.32 (11H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.51-1.63 (5H, m), 1.98 (1H, m), 2.50 (1H, brs), 3.31 (3H, s), 3.34 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.81 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.81 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 6.97 (1H, dd, $J = 0.9$ and 4.8 Hz), 7.06 (1H, m), 7.29 (1H, dd, $J = 3.0$ and 4.8 Hz), 7.34 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 3426, 1643, 1543, 1506, 1460, 1113 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.5} +43.0 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{35}\text{NO}_2\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 67.37; H, 7.92; N, 3.14; S, 14.39 実測値 (%): C, 67.32; H, 7.91; N, 3.19; S, 14.32
I-7A-104a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.95 (1H, m), 1.18-1.70 (16H, m), 2.00 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 2.32 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.50 (1H, m), 3.82 (1H, m), 4.10 (2H, s), 5.87 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.70 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.95 (1H, dd, $J = 5.4$, 3.6 Hz), 7.04 (1H, dd, $J = 3.6$, 1.2 Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.36 (1H, dd, $J = 5.4$, 1.2 Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3446, 3427, 2671, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +39.4 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_3$) 計算値 (%): C, 60.84; H, 6.54; N, 2.93; S, 20.14 実測値 (%): C, 60.12; H, 6.51; N, 3.05; S, 19.95
I-7A-143a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.97 (1H, m), 1.16-1.70 (16H, m), 2.00 (1H, m), 2.31 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.58 (1H, m), 3.93 (1H, m), 4.24 (2H, s), 6.01 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.18-7.32 (6H, m), 7.42 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.80 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J = 7.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3438, 1709, 1651, 1516, 1495 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.0} +41.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{36}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 73.05; H, 7.23; N, 2.84; S, 6.50 実測値 (%): C, 73.10; H, 7.13; N, 2.86; S, 6.39
I-7A-197a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, m), 1.18-1.68 (16H, m), 1.97 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 2.31 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.48 (1H, m), 3.22 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 3.81 (1H, m), 4.07 (2H, s), 4.57 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 5.82 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.79 (1H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.80 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.96 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.09 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 7.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3446, 3427, 2671, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +37.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 69.05; H, 7.39; N, 2.88; S, 6.58 実測値 (%): C, 69.11; H, 7.24; N, 2.99; S, 6.61
I-7A-315a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.00 (1H, m), 1.23-1.63 (16H, m), 2.00 (1H, m), 2.31 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 2.58 (1H, m), 3.94 (1H, m), 4.26 (2H, s), 6.06 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.00-7.18 (5H, m), 7.42 (1H, m), 7.82 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J = 7.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3438, 2954, 2927, 2875, 2856, 1709, 1653, 1516, 1492, 1456, 1396, 1298, 1271 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.5} +39.0 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.04$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{34}\text{FNO}_3\text{S} \cdot 0.5\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 69.95; H, 6.93; N, 2.67; F, 3.63; S, 6.12 実測値 (%): C, 70.24; H, 6.80; N, 2.98; F, 3.19; S, 6.08

表 2 5

化合物番号	物性値
I-7A-316a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.98 (1H, m), 1.22-1.63 (16H, m), 2.00 (1H, m), 2.31 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.58 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.92 (1H, m), 4.23 (2H, s), 6.03 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.85-6.91 (2H, m), 7.02-7.23 (3H, m), 7.39 (1H, m), 7.83 (1H, s), 8.14 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (CHCl_3) 3518, 3438, 2954, 2929, 1709, 1653, 1601, 1516, 1493, 1464, 1439, 1394, 1246 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.0} +35.2 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.03$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 71.15; H, 7.20; N, 2.68; S, 6.13 実測値 (%): C, 71.03; H, 7.35; N, 2.86; S, 5.99
I-7B-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.98-2.49 (20H, m), 1.14 (3H, d, $J = 6.9$ Hz), 3.80 (1H, m), 6.05 (1H, d, $J = 5.2$ Hz), 6.33 (2H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.16 (2H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.35 (1H, m), 7.57 (1H, m); IR (CHCl_3) 3442, 2954, 2929, 2877, 2858, 1705, 1657, 1529, 1504, 1456, 1383, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.5} +41.6 \pm 1.6^\circ$ ($c=0.50$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 57.98; H, 6.70; N, 5.54; S, 12.69 実測値 (%): C, 58.27; H, 6.47; N, 5.50; S, 12.33
I-7D-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.98 (1H, m), 1.22-2.33 (17H, m), 2.48 (1H, m), 3.79 (1H, m), 4.92 (1H, dt, $J = 6.0$ and 44.1 Hz), 6.07 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.33 (2H, d, $J = 4.8$ Hz), 7.16 (2H, d, $J = 4.8$ Hz), 7.36 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3440, 2956, 2875, 1732, 1657, 1531, 1504, 1456, 1383, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +30.2 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.02$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 55.28; H, 6.01; N, 5.53; F, 3.75; S, 12.67 実測値 (%): C, 55.58; H, 6.14; N, 5.61; S, 12.05
I-7E-1c	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.18-1.30 (3H, m), 1.40-1.45 (2H, m), 1.57-1.82 (5H, m), 1.95-2.28 (6H, m), 2.54 (1H, br s), 3.75 (1H, m), 5.26 (1H, br), 5.30-5.46 (2H, m), 5.89 (1H, br), 6.33 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 6.69 (1H, br d, $J = 6.0$ Hz), 7.17 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3527, 3485, 3442, 3411, 3340, 1674, 1531, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +79.9 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.43; H, 6.20; N, 8.74; S, 13.33 実測値 (%): C, 57.55; H, 6.50; N, 8.76; S, 13.28
I-7E-1d	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.19-1.27 (3H, m), 1.40-1.45 (2H, m), 1.56-1.82 (5H, m), 1.97-2.20 (6H, m), 2.56 (1H, br s), 2.75 (3H, d, $J = 4.8$ Hz), 3.73 (1H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 5.90 (1H, br), 6.33 (2H, t, $J = 2.1$ Hz), 6.79 (1H, br d, $J = 7.8$ Hz), 7.16 (2H, t, $J = 2.1$ Hz), 7.54 and 7.57 (each 1H, ABq, $J = 3.9$ Hz); $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +76.1 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.23; H, 6.43; N, 8.49; S, 12.95 実測値 (%): C, 58.22; H, 6.64; N, 8.45; S, 12.81

表 2 6

化合物番号	物性値
I-7E-1e	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.16-2.24 (13H, m), 2.32 (2H, d, $J = 7.2$ Hz), 2.57 (1H, m), 3.27 (3H, s), 3.74 (1H, m), 5.25-5.32 (2H, m), 6.14 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.35 (2H, d, $J = 4.8$ Hz), 7.18 (2H, d, $J = 4.8$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 9.96 (1H, s); IR (CHCl_3) 2956, 2879, 1716, 1645, 1533, 1506, 1456, 1385, 1342, 1167, 1122, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +90.4 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.00$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{N}_8\text{O}_6\text{S}_3 \cdot 0.8\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 51.41; H, 5.95; N, 7.25; S, 16.60 実測値 (%): C, 51.77; H, 5.70; N, 7.53; S, 16.22
I-7E-1f	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.07-2.19 (13H, m), 2.51 (1H, m), 2.58 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 3.22 (3H, s), 3.27 (3H, s), 3.84 (1H, m), 5.32-5.43 (2H, m), 6.26 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.33 (2H, d, $J = 4.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J = 4.5$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3394, 2956, 2877, 1699, 1655, 1531, 1504, 1456, 1381, 1354, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.5} +47.4 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.00$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{33}\text{N}_3\text{O}_6\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 52.55; H, 5.89; N, 7.35; S, 16.84 実測値 (%): C, 52.85; H, 5.81; N, 7.26; S, 16.45
I-7E-1g	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.12-1.86 (9H, m), 2.01-2.10 (5H, m), 2.55 (1H, br s), 2.96-3.04 (2H, m), 3.57 (1H, m), 5.27-5.40 (2H, m), 6.36 (2H, t, $J = 2.1$ Hz), 7.17 (2H, t, $J = 2.1$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3462, 3336, 1657, 1531, 1506, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1036 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +74.0 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_6\text{O}_8\text{S}_2 \cdot 0.4\text{Et}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.72; H, 6.08; N, 15.85; S, 12.09 実測値 (%): C, 55.45; H, 6.10; N, 15.85; S, 11.84
I-7E-1h	mp 123-125 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.09 (1H, m), 1.16-1.75 (10H, m), 1.99-2.20 (5H, m), 2.52 (1H, brs), 3.63 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 3.81 (1H, m), 5.28-5.44 (2H, m), 6.24 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.37 and 7.57 (each 1H, each d, each $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3388, 3255, 1618, 1552, 1373, 1190, 1163, 1057, 1039 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +80.1 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 59.71; H, 6.54; N, 6.06; S, 13.86 実測値 (%): C, 59.59; H, 6.50; N, 6.08; S, 13.82
I-7E-1i	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.06 (1H, m), 1.19-1.31 (2H, m), 1.34-1.44 (4H, m), 1.52-1.65 (4H, m), 2.01-2.13 (5H, m), 2.53 (1H, brs), 3.32 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 3.82 (1H, m), 5.28-5.44 (2H, m), 6.15 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.32-6.34 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.35 and 7.57 (each 1H, each d, each $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3442, 1658, 1529, 1504, 1456, 1382, 1192, 1167, 1115, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +73.8 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.02; H, 6.80; N, 5.83; S, 13.35 実測値 (%): C, 60.09; H, 6.75; N, 5.79; S, 13.19

表 2 7

化合物番号	物性値
I-7E-47i	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.08 (1H, m), 1.21-1.31 (2H, m), 1.21-1.31 (2H, m), 1.37-1.46 (4H, m), 2.01-2.13 (5H, m), 2.53 (1H, brs), 3.32 (3H, s), 3.37 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.82 (1H, m), 5.28-5.43 (2H, m), 6.19 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.19 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 3.9$ and 5.1 Hz), 7.39 and 7.63 (each 1H, each d, each $J = 3.9$ Hz), 7.69 (1H, dd, $J = 1.5$ and 5.1 Hz), 7.75 (1H, dd, $J = 1.5$ and 3.9 Hz); IR (CHCl_3) 3442, 1657, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1115, 1097, 1020 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +76.3 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_3 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.34; H, 6.42; N, 2.79; S, 19.14 実測値 (%): C, 57.25; H, 6.25; N, 2.83; S, 19.25
I-7E-88e	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.11-1.66 (9H, m), 1.93-2.34 (7H, m), 2.59 (1H, m), 3.24 (3H, s), 3.70 (1H, m), 4.17 (2H, s), 5.21-5.31 (2H, m), 5.92 (1H, d, $J = 9.6$ Hz), 6.84 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.98 (1H, dd, $J = 1.5$ and 4.8 Hz), 7.08 (1H, dd, $J = 1.2$ and 1.8 Hz), 7.30 (1H, m), 7.50 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 10.78 (1H, s); IR (CHCl_3) 3444, 3425, 2954, 2877, 1714, 1630, 1545, 1510, 1456, 1408, 1342, 1169, 1122 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +66.0 \pm 2.1^\circ$ ($c=0.50$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.07; H, 6.25; N, 5.32; S, 18.28 実測値 (%): C, 57.38; H, 6.34; N, 5.52; S, 17.92
I-7E-88h	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.04 (1H, m), 1.19-1.75 (10H, m), 2.02-2.24 (5H, m), 2.53 (1H, brs), 3.63 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.83 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.30-5.44 (2H, m), 5.90 (1H, d, $J = 6.9$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 1.5$ and 4.8 Hz), 7.05 (1H, dd, $J = 1.5$ and 3.0 Hz), 7.28 (1H, dd, $J = 3.0$ and 4.8 Hz), 7.35 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3624, 3446, 3429, 1643, 1545, 1506 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +74.7 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_2\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 66.54; H, 7.31; N, 3.23; S, 14.80 実測値 (%): C, 66.55; H, 7.26; N, 3.38; S, 14.57
I-7E-88i	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.03 (1H, m), 1.18-1.29 (2H, m), 1.34-1.47 (4H, m), 1.53-1.67 (4H, m), 2.01-2.14 (5H, m), 2.54 (1H, brs), 3.32 (3H, s), 3.36 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.84 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.29-5.43 (2H, m), 5.90 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.79 (1H, dt, $J = 3.9$ and 0.9 Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 1.5$ and 5.1 Hz), 7.06 (1H, m), 7.29 (1H, dd, $J = 3.0$ and 5.1 Hz), 7.35 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 3429, 1643, 1543, 1506, 1458, 1115 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +68.1 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.019$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{33}\text{NO}_2\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 67.13; H, 7.53; N, 3.13; S, 14.34 実測値 (%): C, 67.10; H, 7.53; N, 3.21; S, 14.32

表 2 8

化合物番号	物性値
I-7F-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.09-2.51(16H, m), 1.17 (3H, m), 3.80 (1H, s), 5.28-5.42 (2H, m), 6.24 (1H, m), 6.33 (2H, d, J = 4.5 Hz), 7.15 (2H, d, J = 4.5 Hz), 7.39 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.56 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 2956, 2877, 1705, 1657, 1531, 1504, 1456, 1383, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +49.0±0.9° (c=1.00, CHCl ₃) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.7H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.28; H, 6.29; N, 5.57; S, 12.74 実測値 (%): C, 57.49; H, 6.11; N, 5.66; S, 12.46
I-7G-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.06-2.18 (14H, m), 1.21 (6H, s), 2.51 (1H, m), 2.75 (1H, m), 5.27-5.43 (2H, m), 6.17 (1H, d, J = 6.9 Hz), 6.33 (2H, dd, J = 4.5 and 2.4 Hz), 7.16 (2H, dd, J = 4.5 and 2.4 Hz), 7.37 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.57 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 2956, 2877, 1728, 1699, 1657, 1531, 1504, 1475, 1456, 1383, 1167, 1074, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +43.4±0.8° (c=1.00, CHCl ₃)
I-7G-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.04-2.24(14H, m), 1.20 (3H, s), 1.21 (3H, s), 2.50 (1H, m), 3.85 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.29-5.43 (2H, m), 5.97 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 5.1 and 1.2 Hz), 7.05 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.29 (1H, m), 7.37 (1H, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3446, 3427, 2956, 2877, 1728, 1699, 1743, 1545, 1506, 1475, 1458, 1282, 1024 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁸ +48.6±0.9° (c=1.02, CHCl ₃) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₃ NO ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 65.46; H, 7.10; N, 2.94; S, 13.44 実測値 (%): C, 65.66; H, 6.96; N, 3.12; S, 13.05
I-7G-126a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.95(1H, d, J = 9.9 Hz), 1.08 (3H, s), 1.17 (3H, s), 1.90 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.53-2.51 (12H, m), 3.84 (3H, s), 4.12 (2H, s), 4.24 (1H, m), 5.39-5.43 (2H, m), 6.04 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.77 (1H, d, J = 2.7 Hz), 6.86-6.92 (2H, m), 7.14-7.23 (2H, m), 7.31 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3450, 3431, 2924, 1728, 1699, 1641, 1601, 1543, 1506, 1471, 1406, 1387, 1367, 1319, 1288, 1126, 1049, 1030 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +29.7±0.7° (c=1.00, CHCl ₃) 元素分析 (C ₃₁ H ₄₁ NO ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 70.37; H, 7.92; N, 2.65; S, 6.06 実測値 (%): C, 70.50; H, 8.03; N, 2.78; S, 5.84
I-7I-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.98 (1H, m), 1.19-1.49 (10H, m), 1.54-1.67 (2H, m), 2.00 (1H, m), 2.16-2.24 (2H, m), 2.48 (1H, brs), 3.81 (1H, m), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.12 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.03 (1H, dt, J = 15.6 and 7.2 Hz), 7.15-7.17 (2H, m), 7.35 and 7.56 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3442, 2681, 1695, 1655, 1529, 1504, 1456, 1425, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.5} +40.1±0.8° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₈ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.31; H, 5.98; N, 5.81; S, 13.30 実測値 (%): C, 57.59; H, 5.98; N, 5.86; S, 14.04

表 2 9

化合物番号	物性値
I-7I-31a	mp 134-136 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.94 (1H, m), 1.18-1.46 (10H, m), 1.54-1.68 (2H, m), 1.98 (1H, m), 2.16-2.23 (2H, m), 2.48 (1H, brs), 3.83 (1H, m), 4.14 (2H, s), 5.79 (1H, dt, J = 15.6 and 1.5 Hz), 5.83 (1H, d, J = 6.9 Hz), 6.78 (1H, d, J = 3.3 Hz), 7.03 (1H, dt, J = 6.8 and 15.6 Hz), 7.23-7.33 (5H, m), 7.35 (1H, d, J = 3.3 Hz); IR (KBr) 3329, 1695, 1649, 1616, 1549, 1527, 1454, 1319, 1288 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +35.6±0.8° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ NO ₃ S) 計算値 (%): C, 71.36; H, 7.14; N, 3.20; S, 7.33 実測値 (%): C, 71.15; H, 7.14; N, 3.28; S, 7.22
I-7I-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.00 (1H, m), 1.26-1.46 (10H, m), 1.55-1.65 (2H, m), 2.00 (1H, m), 2.17-2.24 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.82 (1H, m), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.16 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.03 (1H, dt, J = 15.6 and 7.1 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 3.6 and 4.8 Hz), 7.40 and 7.63 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.2 and 4.8 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 1.2 and 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3442, 3375, 2681, 1695, 1653, 1529, 1504, 1402, 1336, 1402, 1153, 1095, 1022 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +40.3±0.8° (c=1.015, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₇ NO ₆ S ₃ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.55; H, 5.55; N, 2.82; S, 19.35 実測値 (%): C, 55.52; H, 5.46; N, 2.92; S, 19.31
I-7I-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.95 (1H, m), 1.21-1.46 (10H, m), 1.55-1.68 (2H, m), 1.98 (1H, m), 2.16-2.33 (2H, m), 2.49 (1H, brs), 3.83 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 5.88 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.95-7.08 (3H, m), 7.28 (1H, dd, J = 3.0 and 4.8 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3446, 3427, 2679, 1695, 1647, 1545, 1506, 1458, 1300, 1281 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +34.7±0.7° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₂₉ NO ₃ S ₂) 計算値 (%): C, 64.98; H, 6.59; N, 3.16; S, 14.46 実測値 (%): C, 64.71; H, 6.61; N, 3.24; S, 14.17
I-7I-93a	mp 116-120°C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.95 (1H, m), 1.21-1.68 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.17-2.23 (2H, m), 2.48 (1H, br s), 3.84 (1H, m), 4.34 (2H, s), 5.80 (1H, br d, J = 15.6 Hz), 5.84 (1H, d), 6.85 (1H, br d, J = 3.3 Hz), 6.90 (1H, m), 6.95 (1H, dd, J = 3.6, 5.1 Hz), 7.02 (1H, dt, J = 15.9, 6.9 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.3 Hz); IR (Nujol) 3032, 1695, 1648, 1542, 1506, 1458, 1223, 1213 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{26.0} +37.6±0.8° (c=1.015, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₂₉ NO ₃ S ₂ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 64.72; H, 6.61; N, 3.14; S, 14.40 実測値 (%): C, 64.64; H, 6.58; N, 3.24; S, 14.50

表 3 0

化合物番号	物性値
I-7I-126a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.93 (1H, m), 1.20-1.48 (10H, m), 1.54-1.64 (2H, s), 1.97 (1H, d, J = 3.6 Hz), 2.19 (2H, dd, J = 13.8, 6.9 Hz), 2.47 (1H, m), 3.84 (3H, s), 4.12 (2H, s), 5.80 (1H, dt, J = 15.6, 1.5 Hz), 5.81 (1H, d, J = 6.9 Hz), 6.78 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.86-6.93 (2H, m), 7.01 (1H, dt, J = 15.6, 6.9 Hz), 7.16 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.22 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.31 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3276, 3079, 3058, 2678, 1691, 1604, 1552, 1456, 1319, 1247 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{27.0} +34.3±0.7° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₃ NO ₄ S) 計算値 (%): C, 69.35; H, 7.11; N, 3.00; S, 6.86 実測値 (%): C, 69.19; H, 7.10; N, 3.12; S, 6.62
I-7I-143a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.00 (1H, m), 1.21-1.50 (10H, m), 1.59-1.65 (2H, m), 2.00 (1H, m), 2.17-2.21 (2H, m), 2.57 (1H, brs), 3.94 (1H, m), 4.24 (2H, s), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.07 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.03 (1H, dt, J = 15.6 and 7.2 Hz), 7.18-7.30 (6H, m), 7.42 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.81 (1H, s), 8.18 (1H, d, J = 7.8 Hz); IR (CHCl ₃) 3523, 3438, 2683, 1695, 1651, 1516, 1495 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +41.7±0.8° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C ₃₀ H ₃₃ NO ₃ S) 計算値 (%): C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55 実測値 (%): C, 73.54; H, 6.77; N, 2.92; S, 6.49
I-7I-270a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.18-1.70 (12H, m), 2.01 (1H, brd), 2.17-2.24 (2H, m), 2.42 (6H, s), 2.48 (1H, brs), 3.81 (1H, m), 5.79 (1H, dt, J = 15.6, 1.5 Hz), 5.88 (2H, s), 6.05 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.03 (1H, dt, J = 15.6, 6.9 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.50 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3525, 3442, 2677, 1695, 1655, 1529, 1504, 1375, 1180, 1119 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +37.7±0.8° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.87; H, 6.44; N, 5.49; S, 12.57 実測値 (%): C, 58.99; H, 6.39; N, 5.51; S, 12.48
I-7I-307a	mp 171-173 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, m), 1.17-1.41 (10H, m), 1.50-1.59 (2H, m), 1.93 (1H, m), 2.12-2.19 (2H, m), 2.44 (1H, m), 3.78 (1H, m), 3.97 (3H, s), 4.59 (2H, s), 5.77 (1H, d, J = 15.6 Hz), 5.81 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.75 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.01 (1H, dt, J = 15.6, 7.1 Hz), 7.28 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.25-7.36 (3H, m), 7.46 (1H, m), 7.78-7.82 (1H, m), 7.92 (1H, d, J = 8.7 Hz); IR (Nujol) 3365, 3059, 2638, 1689, 1622, 1552, 1527, 1516, 1464, 1263, 1252, 1092 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.5} +31.6±0.7° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C ₃₁ H ₃₅ NO ₄ S) 計算値 (%): C, 71.92; H, 6.81; N, 2.71; S, 6.19 実測値 (%): C, 71.62; H, 6.90; N, 2.79; S, 6.20
I-7I-327a	mp 176-179 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.98 (1H, m), 1.20-1.70 (12H, m), 2.00 (1H, d, J = 3.6 Hz), 2.16-2.24 (2H, m), 2.47 (1H, br s), 3.00 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.80 (1H, m), 3.98 (2H, t, J = 8.4 Hz), 5.79 (1H, dt, J = 1.8, 15.3 Hz), 6.01 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.97-7.24 (4H, m), 7.33 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.46 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.58 (1H, d, J = 8.4 Hz); IR (Nujol) 3332, 2925, 2854, 1689, 1608, 1554, 1479, 1460, 1365, 1238, 1161 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁸ +36.3±0.8° (c=1.012%, MeOH); 元素分析 (C ₂₇ H ₃₂ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%) C, 61.34; H, 6.10; N, 5.30; S, 12.13 実測値 (%) C, 61.08; H, 6.22; N, 5.24; S, 11.82

表 3 1

化合物番号	物性値
I-7I-332a	mp 136-139 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.98 (1H, m), 1.20-1.82 (14H, m), 2.01 (1H, d, J = 3.0 Hz), 2.21 (2H, q, J = 6.9 Hz), 2.48 (1H, br s), 2.53 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.79-3.87 (3H, m), 5.79 (1H, dt, J = 1.5, 15.6 Hz), 6.01 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.97-7.26 (5H, m), 7.31 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.77 (1H, dd, J = 0.9, 7.8 Hz); IR (Nujol) 3371, 3325, 2922, 1728, 1693, 1614, 1549, 1342, 1163 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +35.4±0.8° (c=1.009%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₄ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%) C, 61.97; H, 6.31; N, 5.16; S, 11.82 実測値 (%) C, 61.94; H, 6.47; N, 5.14; S, 11.69
I-7I-343a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.07 (1H, m), 1.22-1.62 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.22 (1H, m), 2.54 (1H, m), 3.94 (1H, m), 5.80 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.27 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.02 (1H, m), 7.45-7.60 (5H, m), 7.89 (1H, s), 7.99-8.05 (3H, m), 8.59 (1H, d, J = 8.1 Hz); IR (KBr) 3381, 3292, 3066, 2949, 2927, 2873, 1685, 1655, 1620, 1558, 1477, 1446, 1385, 1319, 1308, 1284, 1244, 1230, 1209 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{26.0} +32.6±1.5° (c=0.50, DMSO) 元素分析 (C ₂₉ H ₃₁ NO ₅ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 63.92; H, 5.88; N, 2.57; S, 11.77 実測値 (%) C, 64.07; H, 5.82; N, 2.75; S, 11.41
I-7I-385a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.03 (1H, m), 1.20-1.74 (12H, m), 2.04 (1H, m), 2.14-2.26 (2H, m), 2.57 (1H, m), 3.97 (1H, m), 5.77 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.27 (2H, t, J = 2.4 Hz), 6.37 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.02 (1H, dt, J = 15.6, 6.9 Hz), 7.22 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.67 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.37 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.44 (1H, s); IR (CHCl ₃) 3452, 3023, 2954, 2877, 1695, 1650, 1516, 1456, 1373, 1282, 1188, 1163, 1057 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{22.0} +39.4 ±0.8° (c=1.017, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%) C, 61.36; H, 5.76; N, 5.30; S, 12.14 実測値 (%) C, 61.26; H, 5.89; N, 5.11; S, 11.95
I-7I-389a	mp 140-143 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, m), 1.21-1.46 (10H, m), 1.54-1.64(2H,m), 1.99 (1H, m), 2.23 (3H, s) + 2.16-2.23 (2H, m), 2.48(1H, m), 3.21 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.81 (1H, m), 4.62 (2H, t, J = 8.7 Hz), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 5.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.89 (1H, s), 6.96 (1H, s), 7.02(1H, dd, J = 15.6,6.9 Hz), 7.08 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3294, 3066, 2675, 1695, 1649, 1604, 1550, 1512, 1327, 1203 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +29.2±0.7° (c=1.013, MeOH) 元素分析 (C ₂₈ H ₃₃ NO ₄ S ₂) 計算値 (%) C, 65.72; H, 6.50; N, 2.74; S, 12.53 実測値 (%) C, 65.57; H, 6.62; N, 2.62; S, 12.37

表 3 2

化合物番号	物性値
I-7I-391a	mp 204-207 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.01 (1H, m), 1.25-1.46 (10H, m), 1.54-1.64(2H, m), 2.00 (1H, m), 2.17-2.23 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.48(1H, m), 3.18 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.81 (1H, m), 4.71 (2H, t, J = 8.7 Hz), 5.79 (1H, d, J = 15.6 Hz), 6.20 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.02 (1H, dt, J = 15.6, 6.9 Hz), 7.21 (1H, s), 7.41 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.50 (1H, s), 7.70 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3398, 3197, 3086, 1716, 1689, 1639, 1541, 1313, 1151 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +37.9±0.8° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C ₂₈ H ₃₃ NO ₆ S ₂) 計算値 (%): C, 61.85; H, 6.12; N, 2.58; S, 11.80 実測値 (%): C, 61.61; H, 6.08; N, 2.50; S, 11.69
I-7J-1a	mp 116-118 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.19-1.82 (12H, m), 1.79 (3H, d, J = 1.2 Hz), 2.01 (1H, m), 2.17 (2H, br q, J = 7.8 Hz), 2.48 (1H, m), 3.82 (1H, m), 6.00 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 6.85 (1H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.33 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.63 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.57 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3354, 3141, 3099, 3076, 2669, 2557, 1682, 1641, 1624, 1539, 1390, 1375, 1302, 1190, 1167 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ 37.1±0.6° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%): C, 58.75; H, 6.16; N, 5.71; S, 13.07 実測値 (%): C, 58.55; H, 6.14; N, 5.70; S, 12.89
I-7K-1a	mp 168-171 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.20-1.82 (12H, m), 2.01-2.20 (3H, m), 2.12 (3H, d, J = 0.9 Hz), 2.48 (1H, m), 3.82 (1H, m), 4.05 (2H, s), 5.65 (1H, s), 5.97 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.33-6.35 (2H, m), 7.16-7.18 (2H, m), 7.33 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.63 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3330, 3086, 1693, 1633, 1614, 1544, 1456, 1377, 1250, 1194, 1169, 1057 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +34.0±1.5° (c=0.509, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.6CHCl ₃) 計算値 (%): C, 52.55; H, 5.49; N, 4.98; S, 11.41; Cl, 11.35 実測値 (%): C, 52.62; H, 5.19; N, 4.93; S, 11.11; Cl, 10.53
I-7M-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.00-1.70 (13H, m), 2.01 (1H, m), 2.47 (1H, m), 3.52 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.82 (1H, m), 4.04 (2H, s), 5.54-5.70 (2H, m), 6.13 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.18 (2H, m), 7.37 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.57 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3440, 1778, 1731, 1655, 1531, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1128, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +40.9±0.8° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C ₂₂ H ₂₈ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.17; H, 5.95; N, 5.74; S, 13.15 実測値 (%): C, 54.51; H, 6.00; N, 5.58; S, 12.76
I-7M-1e	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.02-1.70 (13H, m), 2.02 (1H, m), 2.48 (1H, m), 3.31 (3H, s), 3.50 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.85 (1H, m), 3.99 (2H, s), 6.05 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.34 (2H, m), 7.16 (2H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.88 (1H, s); IR (CHCl ₃) 3442, 3352, 2956, 2877, 1730, 1657, 1531, 1504, 1456, 1423, 1402, 1385, 1350, 1167, 1076, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.5} +35.6±0.8° (c=1.00, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₃₁ N ₃ O ₇ S ₃ ·0.8MeOH) 計算値 (%): C, 48.29; H, 5.74; N, 7.34; S, 16.81 実測値 (%): C, 48.00; H, 5.68; N, 7.74; S, 17.12

表 3 3

化合物番号	物性値
I-7M-40a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.03 (1H, m), 1.22-1.74 (12H, m), 2.01 (1H, m), 2.51 (1H, br s), 3.54 (2H, dt, $J = 1.5, 6.3$ Hz), 3.91 (1H, m), 4.05 (2H, s), 6.03 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.25-7.64 (7H, m); IR (CHCl_3) 2954, 1780, 1732, 1643, 1541, 1510, 1491, 1454, 1219, 1213, 1132 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +50.9 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.013\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 66.03; H, 6.93; N, 3.21; S, 7.34 実測値 (%) C, 66.14; H, 6.92; N, 3.26; S, 7.22
I-7M-43a	mp 132-134 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.01 (1H, m), 1.20-1.75 (12H, m), 2.01 (1H, d, $J = 3.0$ Hz), 2.47 (1H, br s), 3.53 (2H, t, $J = 6.0$ Hz), 3.79-3.96 (5H, m), 4.05 (2H, s), 6.06 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.85 (1H, dd, $J = 1.5, 8.1$ Hz), 6.96 (1H, m), 7.11 (1H, m), 7.29 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.34 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.83 (1H, dd, $J = 1.5, 8.1$ Hz); IR (Nujol) 3325, 3084, 2924, 1730, 1612, 1562, 1491, 1460, 1369, 1250, 1236, 1165, 1138 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +53.6 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.009\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{NO}_4\text{S}_2$) 計算値 (%) C, 60.94; H, 6.28; N, 3.23; S, 14.79 実測値 (%) C, 60.77; H, 6.32; N, 3.38; S, 14.51
I-7M-47a	mp 116-118 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.06 (1H, m), 1.19-1.70 (12H, m), 2.00 (1H, m), 2.49 (1H, m), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 3.84 (1H, m), 4.05 (2H, s), 6.21 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 3.9, 4.5$ Hz), 7.42 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.63 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J = 0.9, 4.8$ Hz), 7.75 (1H, dd, $J = 0.9, 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3319, 3097, 2557, 1732, 1618, 1566, 1444, 1432, 1321, 1232, 1151, 1031 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +44.4 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{NO}_6\text{S}_3$) 計算値 (%) C, 53.10; H, 5.47; N, 2.81; S, 19.33 実測値 (%) C, 52.90; H, 5.37; N, 2.91; S, 19.10
I-7M-59a	mp 103-104 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.99 (1H, m), 1.20-1.70 (12H, m), 1.99 (1H, d, $J = 3.3$ Hz), 2.45 (1H, m), 3.23 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.48-3.55 (2H, m), 3.84 (1H, m), 4.04 (2H, s), 5.89 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.01 (1H, dd, $J = 3.6, 5.1$ Hz), 7.04 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.29 (1H, dd, $J = 1.5, 3.6$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.43 (1H, dd, $J = 1.5, 5.1$ Hz); IR (Nujol) 3332, 2922, 2854, 1930, 1601, 1564, 1458, 1439, 1331, 1230, 1134 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +40.0 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.004\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{NO}_4\text{S}_3$) 計算値 (%) C, 56.75; H, 5.84; N, 3.01; S, 20.66 実測値 (%) C, 56.59; H, 5.81; N, 3.04; S, 20.65
I-7M-88a	mp 90-91.5 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.00 (1H, m), 1.18-1.70 (12H, m), 1.99 (1H, m), 2.46 (1H, m), 3.52 (2H, dt, $J = 1.8, 8.7$ Hz), 3.87 (1H, m), 4.04 and 4.16 (each 2H, s), 4.58 (1H, br s), 5.91 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.80 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 1.2, 5.1$ Hz), 7.06 (1H, m), 7.29 (1H, dd, $J = 3.0, 4.8$ Hz), 7.37 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3332, 3095, 3080, 2553, 1735, 1597, 1562, 1537, 1435, 1325, 1304, 1228, 1146 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +39.8 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S}_2$) 計算値 (%) C, 61.72; H, 6.53; N, 3.13; S, 14.33 実測値 (%) C, 61.60; H, 6.20; N, 3.24; S, 14.01

表 3 4

化合物番号	物性値
I-7M-126a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.96 (1H, m), 1.23-1.26 (2H, m), 1.38-1.46 (6H, m), 1.54-1.63 (4H, s), 1.97 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 2.45 (1H, m), 3.48-3.53 (2H, m), 3.83 (3H, s), 3.85 (1H, m), 4.03 (2H, s), 4.12 (2H, s), 5.88 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.86-6.90 (2H, m), 7.16 (1H, dd, $J = 4.5, 1.8$ Hz), 7.21 (1H, dd, $J = 7.8, 1.8$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3427, 2875, 1639, 1504, 1460, 1248, 1221 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{27.0} +36.8 \pm 1.5^\circ$ ($c=0.508$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.47; H, 7.10; N, 2.94; S, 6.72 実測値 (%): C, 65.30; H, 7.01; N, 3.02; S, 6.54
I-7M-143a	mp 123-125 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.04 (1H, m), 1.20-1.75 (12H, m), 2.01 (1H, br s), 2.55 (1H, br s), 3.53 (2H, dt, $J = 1.8, 6.0$ Hz), 3.98 (1H, m), 4.02 and 4.24 (2H, s), 6.08 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.17-7.45 (7H, m), 7.83 (1H, s), 8.16 (1H, d, $J = 7.8$ Hz); IR (Nujol) 3280, 2924, 1722, 1612, 1566, 1454, 1242, 1228, 1137 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +39.2 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.012\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%) C, 70.85; H, 6.77; N, 2.85; S, 6.52 実測値 (%) C, 70.58; H, 6.70; N, 2.94; S, 6.40
I-7M-197a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.98 (1H, m), 1.20-1.70 (12H, m), 1.98 (1H, d, $J = 3.3$ Hz), 2.45 (1H, m), 3.23 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.49-3.54 (2H, m), 3.86 (1H, m), 4.03 and 4.08 (2H, s), 4.58 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.88 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 6.77-6.82 (2H, m), 6.96 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.10 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.35 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 2954, 1732, 1641, 1545, 1506, 1477, 1458, 1254, 1225, 1221, 1213, 1207, 1130 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +37.2 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.008\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 66.31; H, 6.93; N, 2.86; S, 6.56 実測値 (%) C, 66.24; H, 6.91; N, 2.92; S, 6.52
I-7M-270a	mp.141-143 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.02 (1H, br), 1.18-1.70 (12H, m), 2.01 (1H, brd), 2.42 (6H, s), 2.48 (1H, brs), 3.53 (2H, dt, $J = 0.9, 6.6$ Hz), 3.83 (1H, m), 4.06 (2H, s), 5.88 (2H, s), 6.11 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.36 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3327, 3097, 3084, 2555, 1732, 1616, 1556, 1234, 1219, 1176, 1134, 1113 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +40.5 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 56.67; H, 6.37; N, 5.51; S, 12.61 実測値 (%): C, 56.56; H, 6.10; N, 5.48; S, 12.38
I-7M-307a	mp 131-132 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, m), 1.20-1.23 (2H, m), 1.34-1.39 (6H, m), 1.51-1.63 (4H, m), 1.94 (1H, m), 2.42 (1H, m), 3.45-3.49 (2H, m), 3.81 (1H, m), 3.98 (3H, s), 4.01 (2H, s), 4.59 (2H, s), 5.85 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.75 (1H, d, $J = 3.3$ Hz), 7.28-7.36 (3H, m), 7.47 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.79 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.82 (1H, d, $J = 4.8$ Hz), 7.92 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (Nujol) 3340, 3068, 2744, 2546, 1738, 1604, 1560, 1435, 1250, 1236, 1146 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.5} +36.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 69.07; H, 6.76; N, 2.68; S, 6.15 実測値 (%): C, 68.99; H, 6.87; N, 2.74; S, 6.05

表 3 5

化合物番号	物性値
I-7M-315a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.04 (1H, m), 1.26-1.64 (12H, m), 2.03 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.54 (2H, t, $J = 5.1$ Hz), 3.99 (1H, m), 4.03 (2H, s), 4.26 (2H, s), 6.07-6.10 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.00-7.23 (5H, m), 7.43 (1H, m), 7.85 (1H, s), 8.16 (1H, d, $J = 8.1$ Hz); IR (CHCl_3) 3508, 3437, 2954, 2875, 1780, 1732, 1651, 1518, 1477, 1456, 1396, 1363 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +38.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.03$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{32}\text{FNO}_4\text{S} \cdot 0.6\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 67.22; H, 6.56; N, 2.65; F, 3.59; S, 6.06 実測値 (%): C, 67.31; H, 6.57; N, 2.92; F, 3.21; S, 6.09
I-7M-316a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.04 (1H, m), 1.23-1.68 (11H, m), 2.01 (1H, m), 2.55 (2H, m), 3.54 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.82 (3H, s), 3.99 (1H, m), 4.02 (2H, s), 4.23 (2H, s), 6.09 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.83-6.91 (2H, m), 7.05-7.23 (3H, m), 7.39 (1H, m), 7.85 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 8.1$ Hz); IR (CHCl_3) 3437, 2954, 2875, 1780, 1732, 1651, 1601, 1516, 1493, 1464, 1394, 1363, 1246 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.0} +35.2 \pm 1.5^\circ$ ($c=0.50$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_6\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 68.60; H, 6.79; N, 2.67; S, 6.10 実測値 (%): C, 68.56; H, 6.89; N, 2.86; S, 5.93
I-7M-317a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.03 (1H, m), 1.22-1.65 (11H, m), 2.02 (1H, m), 2.57 (1H, m), 3.54 (2H, d, $J = 6.0$ Hz), 4.00 (1H, m), 4.03 (3H, s), 4.35 (2H, s), 6.10 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.08-7.24 (4H, m), 7.39-7.44 (2H, m), 7.85 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (CHCl_3) 3508, 3437, 2954, 2875, 1780, 1732, 1651, 1568, 1518, 1495, 1475, 1444, 1394, 1363 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.0} +34.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.00$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{32}\text{ClNO}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.21; H, 6.13; N, 2.66; Cl, 6.74; S, 6.10 実測値 (%): C, 66.01; H, 6.32; N, 2.89; Cl, 6.03; S, 5.91
I-7M-318a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.05 (1H, m), 1.22-1.64 (12H, m), 2.01 (1H, m), 2.56 (1H, m), 3.49-3.52 (2H, m), 3.97 (2H, s), 3.50 (1H, m), 4.24 (2H, s), 6.12 (1H, d, $J = 6.3$ Hz), 6.81-6.91 (2H, m), 7.11-7.18 (3H, m), 7.39 (1H, m), 7.84 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 7.8$ Hz); IR (CHCl_3) 3597, 3435, 2954, 2875, 1780, 1730, 1649, 1518, 1496, 1456, 1394, 1363, 1327 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{27.0} +36.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.01$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{33}\text{NO}_6\text{S} \cdot 1.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.81; H, 6.74; N, 2.65; S, 6.06 実測値 (%): C, 65.74; H, 6.59; N, 2.79; S, 5.90
I-7M-327a	mp 137-139 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.01 (1H, m), 1.20-1.70 (12H, m), 2.00 (1H, d, $J = 3.0$ Hz), 2.46 (1H, br s), 3.01 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 3.81 (1H, m), 3.98 (2H, t, $J = 8.4$ Hz), 4.04 (2H, s), 6.11 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.98-7.24 (3H, m), 7.35 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 8.1$ Hz); IR (Nujol) 3325, 2924, 1730, 1616, 1566, 1460, 1444, 1373, 1236, 1163, 1138 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +39.2 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 58.23; H, 6.09; N, 5.22; S, 11.96 実測値 (%) C, 58.19; H, 6.14; N, 5.22; S, 11.85

表 3 6

化合物番号	物性値
I-7M-329a	mp 137-139 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.14-1.60 (13H, m), 1.91 (1H, d, J = 3.0 Hz), 2.29 (1H, br s), 3.05 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.37 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.57 (1H, m), 3.91 (2H, s), 4.01 (2H, t, J = 8.4 Hz), 6.91 (1H, m), 7.27-7.37 (2H, m), 7.78 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.93 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.53 (1H, d, J = 6.9 Hz); IR (Nujol) 3325, 2924, 1730, 1618, 1566, 1460, 1444, 1435, 1375, 1234, 1165, 1138, 1070 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +38.2±0.8° (c=1.015%, MeOH); 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ FN ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%) C, 56.71; H, 5.67; F, 3.45; N, 5.09; S, 11.65 実測値 (%) C, 56.61; H, 5.47; F, 3.32; N, 5.12; S, 11.54
I-7M-330a	mp 158-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.13-1.58 (13H, m), 1.91 (1H, d, J = 3.0 Hz), 2.29 (1H, br s), 2.97 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.37 (2H, t, J = 6.9 Hz), 3.57 (1H, m), 3.91 (2H, s), 3.97 (2H, t, J = 8.4 Hz), 7.10 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 4.5, 8.4 Hz), 7.72 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.92 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.52 (1H, d, J = 6.9 Hz); IR (Nujol) 3325, 3095, 2924, 1732, 1618, 1566, 1481, 1460, 1444, 1373, 1236, 1221, 1167, 1140, 1038 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +38.2±0.8° (c=1.009%, MeOH); 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ FN ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%) C, 56.71; H, 5.67; F, 3.45; N, 5.09; S, 11.65 実測値 (%) C, 56.51; H, 5.74; F, 3.30; N, 5.09; S, 11.57
I-7M-331a	mp 152-154 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.14-1.60 (13H, m), 1.92 (1H, d, J = 2.7 Hz), 2.29 (1H, br s), 2.98 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.37 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.58 (1H, m), 3.91 (2H, s), 3.99 (2H, t, J = 8.4 Hz), 6.88 (1H, ddd, J = 2.4, 8.1, 9.0 Hz), 7.16-7.26 (2H, m), 7.82 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.94 (1H, d, J = 4.2 Hz), 8.54 (1H, d, J = 7.5 Hz); IR (Nujol) 3317, 3091, 2924, 1734, 1616, 1568, 1491, 1460, 1446, 1435, 1371, 1261, 1234, 1221, 1176, 1163, 1142, 1092, 1036 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +38.7±0.8° (c=1.012%, MeOH); 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ FN ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%) C, 56.71; H, 5.67; F, 3.45; N, 5.09; S, 11.65 実測値 (%) C, 56.49; H, 5.36; F, 3.34; N, 5.10; S, 11.27
I-7M-332a	mp 100-103 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.01 (1H, m), 1.20-1.82 (14H, m), 2.01 (1H, d, J = 3.3 Hz), 2.47 (1H, br s), 2.53 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.79-3.88 (3H, m), 4.05 (2H, s), 6.07 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.03-7.23 (4H, m), 7.32 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.78 (1H, dd, J = 0.9, 8.1 Hz); IR (Nujol) 3329, 2925, 1730, 1614, 1562, 1458, 1363, 1346, 1234, 1159 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +37.7±0.8° (c=1.018%, MeOH); 元素分析 (C ₂₇ H ₃₄ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 58.55; H, 6.33; N, 5.06; S, 11.58 実測値 (%) C, 58.84; H, 6.41; N, 5.02; S, 11.30

表 3 7

化合物番号	物性値
I-7M-333a	mp 125-128 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.01 (1H, m), 1.20-1.75 (12H, m), 2.01 (1H, d, J = 3.0 Hz), 2.47 (1H, br s), 3.53 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.79-3.96 (5H, m), 4.05 (2H, s), 6.06 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.85 (1H, dd, J = 1.5, 8.1 Hz), 6.96 (1H, m), 7.11 (1H, m), 7.29 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.34 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.83 (1H, dd, J = 1.5, 8.1 Hz); IR (Nujol) 3325, 3084, 2924, 1730, 1612, 1562, 1491, 1460, 1369, 1250, 1236, 1165, 1138 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +36.4±0.8° (c=1.008%, MeOH); 元素分析 (C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₇ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%) C, 56.36; H, 5.93; N, 5.06; S, 11.57 実測値 (%) C, 56.36; H, 5.72; N, 5.08; S, 11.53
I-7M-334a	mp 127-129 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.02 (1H, m), 1.20-1.70 (12H, m), 2.01 (1H, d, J = 3.3 Hz), 2.48 (1H, br s), 3.05 (2H, dd, J = 5.7, 9.0 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.82 (1H, m), 4.03-4.07 (4H, m), 6.08 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.07-7.33 (5H, m), 7.67 (1H, m); IR (Nujol) 3315, 2924, 1761, 1728, 1616, 1550, 1467, 1363, 1165 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +37.1±0.8° (c=1.010%, MeOH); 元素分析 (C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₆ S ₃ ·0.1Hexane) 計算値 (%) C, 55.72; H, 5.87; N, 4.89; S, 16.78 実測値 (%) C, 55.86; H, 5.94; N, 4.84; S, 16.61
I-7M-336a	mp 209-212 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.11-1.56 (13H, m), 1.91 (1H, m), 2.29 (1H, br s), 3.37 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.58 (1H, m), 3.91 (2H, s), 4.63 (4H, s), 7.20-7.35 (4H, m), 7.77 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.51 (1H, d, J = 7.5 Hz); IR (Nujol) 3332, 2924, 1736, 1616, 1562, 1468, 1354, 1240, 1165, 1140, 1092 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₆ S ₂) 計算値 (%) C, 58.62; H, 6.06; N, 5.26; S, 12.04 実測値 (%) C, 58.38; H, 5.98; N, 5.25; S, 11.82
I-7M-337a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.04 (1H, m), 1.23-1.32 (3H, m), 1.43-1.69 (8H, s), 2.02 (1H, m), 2.52-2.54 (2H, m), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.01 (1H, m), 4.03 (2H, s), 4.28 (2H, s), 6.06 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.01-7.07 (2H, m), 7.15-7.31 (4H, m), 7.65 (1H, dd, J = 7.5, 0.9 Hz), 8.17 (1H, s); IR (CHCl ₃) 3323, 2656, 2548, 1728, 1621, 1562, 1456, 1234, 1130 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{27.0} +26.7±0.7° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C ₂₉ H ₃₂ FNO ₅ ·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 69.31; H, 6.62; N, 2.79; F, 3.58 実測値 (%): C, 69.19; H, 6.67; N, 2.82; F, 3.28
I-7M-342a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.05 (1H, m), 1.22-1.63 (12H, m), 2.01 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.49-3.53 (2H, m), 3.99 (1H, m), 4.01 (2H, s), 6.14 (1H, br), 7.18-7.26 (5H, m), 7.43-7.54 (2H, m), 7.85 (1H, s), 8.32 (1H, d, J = 7.8 Hz); IR (CHCl ₃) 3438, 2954, 2875, 1780, 1730, 1649, 1583, 1516, 1477, 1456, 1375 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{26.0} +38.5±0.8° (c=1.03, MeOH)

表 3 8

化合物番号	物性値
I-7M-343a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.05 (1H, m), 1.24-1.63 (12H, m), 2.05 (1H, m), 2.54 (1H, m), 3.54 (2H, t, $J = 8.1$ Hz), 3.94 (1H, m), 4.03 (2H, s), 6.17 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.45-7.63 (4H, m), 7.94 (1H, s), 8.01-8.11 (3H, m), 8.62 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (CHCl_3) 3437, 3375, 2954, 2875, 1780, 1730, 1518, 1383, 1315, 1309 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +33.3 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.04$, MeOH)
I-7M-385a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.07 (1H, m), 1.20-1.72 (12H, m), 2.04 (1H, m), 2.56 (1H, m), 3.52 (2H, dt, $J = 6.3, 1.8$ Hz), 3.97 (1H, s), 4.03 (2H, s), 6.27 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 6.42 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.21 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.56 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.68 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.38 (1H, dd, $J = 7.8, 1.2$ Hz), 8.43 (1H, s); IR (CHCl_3) 3450, 3103, 3022, 2954, 2875, 1732, 1651, 1518, 1456, 1373, 1221, 1188, 1163, 1057 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{22.0} +39.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.65; H, 5.72; N, 5.26; S, 12.04 実測値 (%): C, 58.40; H, 5.82; N, 5.08; S, 11.88
I-7M-389a	mp 94-96 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.99 (1H, m), 1.21-1.27 (2H, m), 1.38-1.46 (6H, m), 1.55-1.68 (4H, m), 1.99 (1H, m), 2.23 (3H, s), 2.46 (1H, m), 3.21 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.46-3.57 (2H, m), 3.83 (1H, m), 4.05 (2H, s), 4.62 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.95 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.90 (1H, s), 6.96 (1H, s), 7.07 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.37 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3327, 3074, 2750, 2650, 2613, 2551, 1728, 1604, 1562, 1234, 1223, 1136 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{23} +35.5 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 62.88; H, 6.45; N, 2.72; S, 12.44 実測値 (%): C, 62.96; H, 6.46; N, 2.68; S, 12.33
I-7M-390a	mp 99-101 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.99 (1H, m), 1.20-1.27 (2H, m), 1.37-1.45 (6H, m), 1.54-1.63 (4H, m), 1.98 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.46 (1H, m), 3.46-3.56 (2H, m), 3.83 (1H, m), 4.04 (2H, s), 5.95 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.72 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.09 (1H, m), 7.18 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.33 (1H, m), 7.39 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.63 (1H, d, $J = 2.1$ Hz); IR (CHCl_3) 3508, 3444, 3425, 2667, 2567, 1780, 1732, 1645, 1531, 1500, 1421, 1321, 1130 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +36.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 62.69; H, 6.12; N, 2.71; S, 12.40 実測値 (%): C, 62.54; H, 5.98; N, 2.68; S, 12.55

表 3 9

化合物番号	物性値
I-7M-391a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.06 (1H, m), 1.24-1.29 (2H, m), 1.38-1.47 (6H, m), 1.55-1.59 (4H, m), 2.00 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.48 (1H, m), 3.19 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.52 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.83 (1H, m), 4.05 (2H, s), 4.72 (2H, t, J = 8.7 Hz), 6.26 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.22 (1H, s), 7.43 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.50 (1H, s), 7.70 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3508, 3440, 3423, 3377, 2567, 2463, 1778, 1732, 1653, 1529, 1504, 1481, 1327, 1151 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +40.6±0.8° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₃ NO ₇ S ₂ ·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.25; H, 6.16; N, 2.52; S, 11.52 実測値 (%): C, 58.18; H, 6.07; N, 2.45; S, 11.55
I-7M-392a	mp 136-140 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ + CD ₃ OD) δ 1.09 (1H, m), 1.22-1.29 (2H, m), 1.33-1.43 (5H, m), 1.52-1.58 (4H, m), 1.96 (1H, m), 2.48-2.51 (2H, m) + 2.51 (3H, s), 3.42-3.53 (2H, m), 3.75 (1H, m), 4.01 (2H, s), 6.68 (1H, d, J = 7.2 Hz), 6.78 (1H, d, J = 2.1 Hz), 7.48 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.64 (1H, s), 7.74 (1H, d, J = 2.1 Hz), 7.76 (1H, s), 7.82 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3280, 3141, 3114, 3084, 2750, 2650, 2548, 1732, 1618, 1566, 1460, 1323, 1223, 1153, 1126 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +40.5±0.8° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₁ NO ₇ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 59.04; H, 5.76; N, 2.55; S, 11.68 実測値 (%): C, 59.01; H, 5.77; N, 2.51; S, 11.50
I-7M-393a	mp 104-107 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.90 (3H, t, J = 7.4 Hz), 0.98 (1H, m), 1.21-1.64 (16H, m), 1.99 (1H, m), 2.46-2.51 (3H, m), 3.23 (2H, t, J = 8.7 Hz), 3.49-3.55 (2H, m), 3.84 (1H, m), 4.05 (2H, s), 4.62 (2H, t, J = 8.7 Hz), 5.92 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.93 (1H, s), 6.98 (1H, s), 7.07 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.36 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3444, 3425, 2569, 1780, 1732, 1643, 1531, 1498, 1479, 1464, 1419, 1317, 1132 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +33.3±0.7° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C ₃₀ H ₃₉ NO ₅ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 64.19; H, 7.07; N, 2.50; S, 11.42 実測値 (%): C, 64.09; H, 6.95; N, 2.55; S, 11.36
I-7M-396a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.06 (1H, m), 1.26-1.69 (12H, m), 2.03 (1H, m), 2.56 (1H, m), 3.55 (2H, t, J = 5.1 Hz), 4.00 (1H, m), 4.04 (2H, s), 6.11 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.88 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.07-7.19 (3H, m), 7.34-7.42 (3H, m), 7.89 (1H, s), 8.03 (1H, d, J = 8.1 Hz); IR (KBr) 3383, 3076, 2949, 2929, 2868, 2520, 1736, 1604, 1550, 1487, 1466, 1390, 1298, 1281, 1248, 1213, 1134 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +35.4±3.0° (c=0.26, MeOH) 元素分析 (C ₂₈ H ₃₁ NO ₅ S·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 66.91; H, 6.42; N, 2.79; S, 6.38 実測値 (%): C, 66.98; H, 6.35; N, 2.85; S, 6.29
I-7M-412a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.05 (1H, m), 1.22-1.70 (12H, m), 2.01 (1H, d, J = 3.3 Hz), 2.50 (1H, br s), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.92 (1H, m), 4.05 (2H, s), 6.11 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.27-7.62 (6H, m), 7.79 (1H, d, J = 1.8 Hz); IR (CHCl ₃) 3444, 2954, 1780, 1732, 1649, 1547, 1514, 1491, 1219, 1213, 1128 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +49.9±0.9° (c=1.008%, MeOH); 元素分析 (C ₂₄ H ₂₉ NO ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%) C, 66.58; H, 6.89; N, 3.24; S, 7.41 実測値 (%) C, 66.73; H, 6.90; N, 3.35 S, 7.29

表 4 0

化合物番号	物性値
I-7M-424a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.00 (1H, m), 1.22-1.64 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.48 (2H, t, $J = 6.9$ Hz), 3.94 (1H, m), 3.99 (2H, s), 4.15 (2H, s), 6.13 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.84 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.20-7.30 (5H, m), 7.74 (1H, s), 7.79 (1H, d, $J = 2.1$ Hz); IR (KBr) 3433, 3246, 3024, 2954, 2875, 1730, 1639, 1599, 1518, 1495, 1475, 1454, 1421, 1352 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.0} +34.0 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.00$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 67.18; H, 6.65; N, 2.70; S, 6.18 実測値 (%): C, 67.21; H, 6.66; N, 2.71; S, 5.99
I-7M-446a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.00 (1H, m), 1.22-1.64 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.47 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 3.96 (1H, m), 3.98 (2H, s), 4.17 (2H, s), 6.16 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.82 (1H, d, $J = 2.4$ Hz), 6.99-7.22 (4H, m), 7.76 (1H, s), 7.82 (1H, d, $J = 2.4$ Hz); IR (CHCl_3) 3593, 3433, 3244, 2954, 2875, 1728, 1639, 1599, 1518, 1491, 1456, 1421, 1362 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{22.0} +31.2 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.01$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{32}\text{FNO}_5\text{S} \cdot 0.9\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.28; H, 6.29; N, 2.58; F, 3.51; S, 5.92 実測値 (%): C, 64.39; H, 6.29; N, 2.52; F, 3.40; S, 5.72
I-7M-447a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.04 (1H, m), 1.22-1.69 (12H, m), 2.03 (1H, m), 2.55 (1H, m), 3.55 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.96 (1H, m), 4.04 (2H, s), 6.08 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.16 (1H, dd, $J = 8.7$ and 2.7 Hz), 7.25-7.35 (5H, m), 7.88 (1H, s), 8.03 (1H, dd, $J = 9.6$ and 2.7 Hz); IR (CHCl_3) 3510, 3438, 2954, 2875, 1780, 1732, 1655, 1591, 1558, 1514, 1477, 1441, 1383 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +38.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.01$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{30}\text{FNO}_4\text{S}_2 \cdot 0.9\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 61.83; H, 5.89; N, 2.58; F, 3.49; S, 11.79 実測値 (%): C, 61.91; H, 5.73; N, 2.65; F, 3.56; S, 11.67
I-7M-448a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.05 (1H, m), 1.22-1.63 (12H, m), 2.00 (1H, m), 2.53 (1H, m), 3.54 (2H, m), 3.90 (1H, m), 4.04 (2H, s), 6.19 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.47-7.83 (3H, m), 7.85 (1H, dd, $J = 7.8$ and 2.4 Hz), 8.00-8.05 (3H, m), 8.38 (1H, dd, $J = 9.3$ and 2.4 Hz); IR (CHCl_3) 3437, 3386, 2954, 2875, 1780, 1730, 1655, 1601, 1518, 1477, 1446, 1396, 1325, 1309 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +31.5 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.01$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{30}\text{FN}_6\text{S}_2 \cdot 0.9\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.40; H, 5.57; N, 2.43; F, 3.30; S, 11.14 実測値 (%): C, 58.43; H, 5.54; N, 2.38; F, 3.16; S, 10.78
I-7N-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.10-1.70 (7H, m), 2.00-2.32 (3H, m), 2.51 (1H, m), 3.83 (1H, m), 4.07-4.21 (4H, m), 5.54-5.70 (2H, m), 6.26 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.18 (2H, m), 7.38 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3440, 1732, 1655, 1531, 1506, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +67.3 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 54.60; H, 5.54; N, 5.79; S, 13.25 実測値 (%): C, 54.58; H, 5.50; N, 5.65; S, 13.15

表 4 1

化合物番号	物性値
I-7N-1b	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.16-1.70 (7H, m), 2.04 (1H, m), 2.12-2.18 (2H, m), 2.56 (1H, br s), 3.72 (3H, s), 3.78 (1H, m), 4.05-4.16 (4H, m), 5.57-5.76 (2H, m), 6.32-6.34 (2H, m), 6.39 (1H, d, J = 6.6 Hz), 7.15-7.17 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.56 (1H, d, J = 3.9 Hz)
I-7P-1a	¹ H-NMR (CD ₃ OD) δ 1.28-1.64 (8H, m), 2.02-2.13 (3H, m), 2.47 (1H, m), 3.71 (1H, m), 3.98 (2H, s), 4.25 (2H, d, J = 22.2 Hz), 5.30 (1H, dt, J = 8.4 and 22.2 Hz), 6.36 (2H, m), 7.23 (2H, m), 7.70 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.75 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3419, 2956, 1635, 1604, 1537, 1508, 1456, 1431, 1381, 1167, 1076, 1057, 1036 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +45.7±0.8° (c=1.02, MeOH)
I-7P-1e	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.10-1.72 (7H, m), 2.06-2.26 (3H, m), 2.51 (1H, m), 3.29 (3H, s), 3.84 (1H, m), 4.01-4.31 (4H, m), 5.36 (1H, dt, J = 9.0 and 20.7 Hz), 6.15 (1H, d, J = 6.6 Hz), 6.34 (2H, m), 7.16 (2H, m), 7.38 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.58 (1H, d, J = 4.2 Hz), 9.26 (1H, s); IR (CHCl ₃) 3442, 3352, 2956, 2829, 1728, 1655, 1531, 1506, 1456, 1452, 1402, 1383, 1348, 1167, 1109, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +51.8±0.9° (c=1.03, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₈ FN ₃ O ₇ S ₃ ·0.5MeOH) 計算値 (%): C, 47.86; H, 5.13; N, 7.13; F, 3.22; S, 16.31 実測値 (%): C, 48.09; H, 5.02; N, 7.38; F, 3.12; S, 16.12
I-7R-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.02 (1H, m), 1.23-1.72 (12H, m), 2.02 (1H, d, J = 3.9 Hz), 2.48 (1H, br s), 2.63 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.21 (2H, s), 3.83 (1H, m), 6.17 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.37 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.57 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (Nujol) 3348, 2924, 1711, 1641, 1622, 1550, 1541, 1456, 1375, 1290, 1190, 1167, 1057 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +42.8±0.8° (c=1.005%, MeOH); 元素分析 (C ₂₂ H ₂₈ N ₂ O ₅ S ₃) 計算値 (%) C, 53.20; H, 5.68; N, 5.64; S, 19.37 実測値 (%) C, 53.41; H, 5.58; N, 5.54; S, 19.08
I-7R-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.99 (1H, m), 1.21-1.72 (12H, m), 1.98 (1H, d, J = 3.9 Hz), 2.47 (1H, br s), 2.64 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.20 (2H, s), 3.87 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.96 (1H, d, J = 7.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.96 (1H, d, J = 4.8 Hz), 7.06 (1H, d, J = 2.1 Hz), 7.26-7.30 (2H, m), 7.37 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 2877, 1711, 1641, 1545, 1508, 1458, 1298, 1282, 1225, 1205 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +42.8±0.8° (c=1.005%, MeOH); 元素分析 (C ₂₃ H ₂₉ NO ₃ S ₃ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%) C, 59.12; H, 6.34; N, 3.00; S, 20.59 実測値 (%) C, 59.18; H, 6.01; N, 3.04; S, 20.28
I-7R-270a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.03 (1H, br), 1.18-1.70 (12H, m), 2.01 (1H, brd), 2.41 (6H, s), 2.46 (1H, brs), 2.62 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.21 (2H, s), 3.82 (1H, m), 5.88 (2H, s), 6.23 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.36 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.49 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3508, 3442, 2673, 1709, 1657, 1531, 1504, 1375, 1180, 1119 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +39.2±0.8° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₂ N ₂ O ₅ S ₃ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%) C, 54.94; H, 6.15; N, 5.34; S, 18.33 実測値 (%) C, 54.44; H, 6.04; N, 5.28; S, 18.08

表 4 2

化合物番号	物性値
I-7R-307a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, m), 1.17-1.22 (2H, m), 1.34-1.41 (6H, m), 1.52-1.58 (4H, m), 1.94 (1H, m), 2.43 (1H, m), 2.59 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.16 (2H, s), 3.79 (1H, m), 3.97 (3H, s), 4.59 (2H, s), 5.90 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.74 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.29-7.36 (2H, m), 7.46 (1H, m), 7.78-7.83 (2H, m), 7.92 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 3425, 3062, 2877, 2673, 1711, 1639, 1597, 1542, 1512, 1265, 1254 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.5} +35.8 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 66.56; H, 6.59; N, 2.59; S, 11.85 実測値 (%): C, 66.53; H, 6.70; N, 2.65; S, 11.78
I-8B-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.06 (1H, m), 1.19-1.30 (2H, m), 1.34-1.44 (4H, m), 1.54-1.68 (4H, m), 2.04-2.12 (5H, m), 2.35 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.51 (1H, brs), 3.82 (1H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 6.21 (1H, d, $J = 6.9$ Hz), 6.32-6.34 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.35 and 7.56 (each 1H, each d, each $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3512, 3442, 2679, 1707, 1657, 1529, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +69.7 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.32; H, 6.20; N, 5.67; S, 12.98 実測値 (%): C, 58.30; H, 6.07; N, 5.67; S, 12.84
I-8C-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.01 (1H, m), 1.25-1.45 (10H, m), 1.53-1.66 (4H, m), 2.00 (1H, m), 2.48 (1H, m), 3.52 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 3.80 (1H, m), 4.08 (2H, s), 6.22 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.38 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3440, 3145, 2578, 1780, 1730, 1657, 1529, 1383, 1192, 1167, 1057 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0} +45.0 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.05; H, 6.19; N, 5.58; S, 12.78 実測値 (%): C, 55.09; H, 6.08; N, 5.61; S, 12.74
I-8C-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.97 (1H, m), 1.23-1.47 (10H, m), 1.55-1.61 (4H, m), 1.97 (1H, m), 2.48 (1H, m), 3.52 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.83 (1H, m), 4.06 (2H, s), 4.16 (2H, s), 5.93 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.79 (1H, dt, $J = 3.9, 0.9$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz), 7.06 (1H, m), 7.29 (1H, dd, $J = 5.1, 3.0$ Hz), 7.37 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3444, 3427, 3107, 3022, 2954, 2875, 1780, 1732, 1643, 1545, 1506, 1221, 1211, 1128 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0} +39.6 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 61.72; H, 6.82; N, 3.00; S, 13.73 実測値 (%): C, 61.79; H, 6.69; N, 3.11; S, 13.59
I-9B-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.06 (1H, m), 1.22-1.45 (8H, m), 1.59-1.67 (4H, m), 2.03-2.13 (5H, m), 2.33 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.52 (1H, brs), 3.82 (1H, m), 5.26-5.42 (2H, m), 6.18 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 6.33-6.34 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.36 and 7.57 (each 1H, each d, each $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3514, 3442, 2677, 1709, 1657, 1529, 1504, 1456, 1383, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.5} +72.2 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 59.50; H, 6.39; N, 5.55; S, 12.71 実測値 (%): C, 59.24; H, 6.48; N, 5.60; S, 12.46

表 4 3

化合物番号	物性値
II-4A-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.40-2.40 (12H, m), 2.38 (3H, s), 4.17 (1H, m), 4.56 (1H, br s), 5.98 (1H, m), 6.19 (1H, t, $J = 3.0$ Hz), 6.24 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.17 (1H, dd, $J = 1.5, 3.3$ Hz), 7.31 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1709, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +28.9 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.86; H, 6.39; N, 5.77; S, 13.20 実測値 (%): C, 57.24; H, 6.36; N, 5.73; S, 12.72.
II-4B-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.43-2.35 (10H, m), 2.38 (3H, s), 4.20 (1H, m), 4.96 (1H, dt, $J = 11.4$ and 49.2 Hz), 5.98 (1H, m), 6.19-6.21 (2H, m), 7.17 (1H, m), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 2925, 2870, 1730, 1657, 1529, 1504, 1471, 1375, 1159, 1144, 1053, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +24.6 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.04$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.6\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 54.95; H, 6.14; N, 5.43; F, 3.68; S, 12.43 実測値 (%): C, 54.94; H, 5.97; N, 5.65; F, 3.55; S, 12.24
II-4C-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.10 and 1.24 (3H, s), 1.56 (1H, ddd, $J = 2.7, 5.7, 12.0$ Hz), 1.96-2.70 (8H, m), 2.37 (3H, s), 4.25 (1H, m), 5.88 (1H, br d, $J = 15.9$ Hz), 5.99 (1H, m), 6.17-6.21 (2H, m), 7.03 (1H, dt, $J = 7.2, 15.9$ Hz), 7.17 (1H, dd, $J = 1.5, 3.3$ Hz), 7.27 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1697, 1655, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +5.4 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.10; H, 6.00; N, 5.79; S, 13.26 実測値 (%): C, 57.14; H, 5.89; N, 5.78; S, 13.01.
II-4D-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.97 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 and 1.23 (3H, s), 1.60 (1H, ddd, $J = 2.7, 5.7, 10.8$ Hz), 1.96-2.40 (6H, m), 2.39 (3H, s), 2.72-3.01 (2H, m), 4.25 (1H, m), 5.85 (1H, br d, $J = 11.7$ Hz), 5.98 (1H, m), 6.17-6.21 (2H, m), 6.40 (1H, dt, $J = 7.8, 11.7$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3519, 3446, 1697, 1658, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +63.6 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.31; H, 5.98; N, 5.81; S, 13.30 実測値 (%): C, 57.48; H, 5.93; N, 5.75; S, 12.90

表 4 4

化合物番号	物性値
II-4F-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.59 (1H, m), 2.03-2.34 (5H, m), 2.39 (3H, s), 2.62 (1H, m), 2.92 (1H, m), 4.26 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.06 (1H, dt, $J = 8.4$ and 21.0 Hz), 6.20 (1H, m), 7.18 (1H, m), 7.28 (1H, m), 7.33 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 33446, 2925, 2870, 1711, 1658, 1529, 1504, 1442, 1375, 1161, 1070, 1053, 1018 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +52.9 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.02$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.8\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 54.95; H, 5.85; N, 5.38; F, 3.65; S, 12.33 実測値 (%): C, 54.72; H, 5.61; N, 5.67; F, 3.43; S, 12.16
II-5A-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.33-2.38 (14H, m), 4.18 (2H, s), 6.08 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.34 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.16 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3512, 3446, 1709, 1657, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +26.2 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.6\text{H}_2\text{O} \cdot 0.3\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 56.33; H, 6.65; N, 5.45; S, 12.40 実測値 (%): C, 56.31; H, 6.35; N, 5.64; S, 12.08
II-5A-31a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.30-2.38 (14H, m), 4.13 (2H, s), 4.18 (1H, m), 5.93 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.20-7.38 (6H, m); IR (CHCl_3) 3512, 3450, 3431, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.0} +20.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 71.04; H, 7.57; N, 3.19; S, 7.29 実測値 (%): C, 69.33; H, 7.65; N, 3.31; S, 7.11
II-5A-47a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.8$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.30-2.38 (14H, m), 4.19 (1H, m), 6.08 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 5.1, 3.9$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.64 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.69 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz), 7.75 (1H, dd, $J = 3.6, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3446, 2679, 1709, 1655, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1095, 1074, 1024 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.0} +23.5 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 54.74; H, 5.99; N, 2.78; S, 19.06 実測値 (%): C, 54.90; H, 5.76; N, 2.85; S, 18.81
II-5A-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.22-2.30 (12H, m), 2.33 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.39 (3H, s), 4.19 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.09 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8, 6.3$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1709, 1657, 1529, 1504, 1375, 1205, 1182, 1161, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +25.3 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 58.51; H, 6.55; N, 5.69; S, 13.02 実測値 (%): C, 58.21; H, 6.53; N, 5.69; S, 12.93

表 4 5

化合物番号	物性値
II-5A-55c	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.89 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.36-2.36 (14H, m), 2.39 (3H, s), 4.16 (1H, m), 5.24 (1H, brs), 5.50 (1H, brs), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.20 (1H, brs), 7.19 (1H, m), 7.32 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.56 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3529, 3446, 3411, 3348, 1678, 1591, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26.0} +23.0 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{33}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.78; H, 6.83; N, 8.42; S, 12.86 実測値 (%): C, 57.79; H, 6.81; N, 8.37; S, 12.68
II-5A-55g	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.89 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.12 (3H, s), 1.25 (3H, s), 1.33-2.35 (12H, m), 2.39 (3H, s), 2.95-3.11 (2H, m), 4.19 (1H, m), 6.00 (1H, m), 6.21 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.45 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J = 3.3, 1.5$ Hz), 7.38 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3149, 2624, 1641, 1533, 1508, 1375, 1205, 1182, 1160 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +17.9 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.018$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_6\text{O}_3\text{S}_2 \cdot 0.4\text{CHCl}_3$) 計算値 (%): C, 51.62; H, 5.79; N, 14.89; S, 11.36 実測値 (%): C, 51.53; H, 5.99; N, 14.82; S, 11.09
II-5A-59a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.07 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.28-2.36 (14H, m), 4.17 (1H, m), 5.91 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.00 (1H, dd, $J = 5.4, 3.6$ Hz), 7.05 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.25 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J = 3.6, 1.2$ Hz), 7.42 (1H, dd, $J = 5.4, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3450, 3431, 2671, 1709, 1645, 1529, 1500, 1471, 1421 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +23.3 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.12; H, 6.34; N, 3.00; S, 20.58 実測値 (%): C, 59.12; H, 6.30; N, 3.07; S, 20.84
II-5A-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.18-2.33 (14H, m), 4.15 (2H, s), 4.19 (1H, m), 5.94 (1H, d, $J = 9.6$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz), 7.05 (1H, dd, $J = 1.8, 1.2$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J = 5.1, 1.8$ Hz), 7.30 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3450, 3431, 1709, 1641, 1545, 1506, 1471 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.0} +19.6 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.91; H, 7.06; N, 3.11; S, 14.22 実測値 (%): C, 63.89; H, 6.89; N, 3.31; S, 14.28
II-5A-104a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.28-2.38 (14H, m), 4.10 (2H, s), 4.20 (1H, m), 5.97 (1H, d, $J = 9.6$ Hz), 6.70 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.95 (1H, m), 7.04 (1H, dd, $J = 3.3, 1.2$ Hz), 7.24 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.37 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3450, 2669, 1709, 1643, 1543, 1508, 1471 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +20.8 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.015$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.67; H, 6.59; N, 2.90; S, 19.91 実測値 (%): C, 59.65; H, 6.49; N, 3.13; S, 20.18

表 4 6

化合物番号	物性値
II-5A-143a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.95 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.04 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.32-2.40 (14H, m), 4.24 (2H, s), 4.32 (1H, m), 6.11 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.16-7.32 (6H, m), 7.42 (1H, dd, $J = 8.1$, 7.2 Hz), 7.76 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J = 8.1$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3442, 1709, 1651, 1513, 1495, 1471 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.0} +31.6 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 72.78; H, 7.25; N, 2.83; S, 6.48 実測値 (%): C, 72.79; H, 7.27; N, 2.87; S, 6.44
II-5A-197a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.30-2.36 (14H, m), 3.22 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 4.07 (2H, s), 4.18 (1H, m), 4.57 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 5.92 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.78 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 6.80 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 6.95 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.09 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3450, 3431, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +41.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 69.05; H, 7.37; N, 2.88; S, 6.58 実測値 (%): C, 69.05; H, 7.20; N, 3.06; S, 6.51
II-5B-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 and 1.23 (3H, s), 1.55 (1H, m), 1.91-2.42 (7H, m), 2.39 (3H, s), 3.18 (2H, d, $J = 6.6$ Hz), 4.20 (1H, m), 5.56-5.73 (2H, m), 5.99 (1H, m), 6.18-6.23 (2H, m), 7.19 (1H, dd, $J = 1.5$, 3.3 Hz), 7.30 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1711, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +38.8 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{39}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.11; H, 6.22; N, 5.65; S, 12.93 実測値 (%): C, 58.13; H, 6.09; N, 5.68; S, 12.73.
II-5C-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.95 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.42-2.33 (10H, m), 4.22 (1H, m), 5.78 (1H, d, $J = 15.9$ Hz), 6.07 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 6.33 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 15.9$, 6.9 Hz), 7.16 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.28 (2H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3523, 3446, 1697, 1655, 1529, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +29.7 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.52; H, 5.96; N, 5.83; S, 13.35 実測値 (%): C, 57.51; H, 5.89; N, 5.88; S, 13.31
II-5C-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 and 1.23 (3H, s), 1.48-2.40 (10H, m), 2.39 (3H, s), 4.24 (1H, m), 5.79 (1H, d, $J = 15.6$ Hz), 5.99 (1H, m), 6.09 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 6.9$, 15.6 Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8$, 3.3 Hz), 7.29 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1697, 1655, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26.5} +27.9 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{39}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.11; H, 6.22; N, 5.65; S, 12.93 実測値 (%): C, 58.12; H, 6.22; N, 5.62; S, 12.91.

表 4 7

化合物番号	物性値
II-5E-1a	mp 154-155 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 and 1.23 (3H, s), 1.51 (1H, ddd, $J = 2.1, 5.1, 12.9$ Hz), 1.72-2.40 (7H, m), 3.58-3.64 (2H, m), 3.98 and 4.07 (each 1H, Abq, $J = 16.8$ Hz), 4.23 (1H, m), 6.27 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.31 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3444, 1730, 1655, 1529, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} -2.2 \pm 0.4^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 54.98; H, 5.87; N, 5.83; S, 13.34 実測値 (%): C, 54.97; H, 5.92; N, 5.89; S, 13.12
II-5E-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.10 and 1.23 (3H, s), 1.51 (1H, ddd, $J = 2.7, 4.8, 12.6$ Hz), 1.74-2.40 (7H, m), 2.39 (3H, s), 3.58-3.64 (2H, m), 3.98 and 4.07 (each 1H, Abq, $J = 17.1$ Hz), 4.23 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 6.29 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.5, 3.3$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3444, 1729, 1655, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1142, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} -2.8 \pm 0.4^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 1.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 53.51; H, 6.33; N, 5.43; S, 12.42 実測値 (%): C, 53.53; H, 5.93; N, 5.45; S, 12.55
II-5F-31a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.47 (1H, ddd, $J = 2.4, 4.8, 12.9$ Hz), 1.74 (1H, m), 1.91-2.38 (6H, m), 2.61-2.80 (2H, m), 3.49 (2H, s), 4.13 (2H, s), 4.21 (1H, m), 6.07 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.77 (1H, dt, $J = 0.9, 3.6$ Hz), 7.22-7.35 (6H, m); IR (CHCl_3) 2924, 1711, 1641, 1543, 1508, 1471, 1454, 1286, 1257, 1227, 1223 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26} +30.7 \pm 1.4^\circ$ ($c=0.512\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 64.85; H, 6.88; N, 3.02; S, 13.85 実測値 (%) C, 64.73; H, 6.81; N, 3.13; S, 13.81
II-5F-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, 10.2 Hz), 1.10 and 1.23 (3H, s), 1.49 (1H, ddd, $J = 2.7, 5.7, 13.5$ Hz), 1.64-2.38 (7H, m), 2.39 (3H, s), 2.60-2.80 (2H, m), 3.21 (2H, ABq, $J = 15.0$ Hz), 4.19 (1H, m), 5.98 (1H, m), 6.20 (1H, t, $J = 3.0$ Hz), 6.25 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.18 (1H, m), 7.33 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 2925, 1710, 1657, 1529, 1504, 1375, 1227, 1213, 1207, 1182, 1161 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26} +29.6 \pm 1.4^\circ$ ($c=0.503\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_3 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 53.34; H, 5.99; N, 5.41; S, 18.57 実測値 (%) C, 53.41; H, 6.01; N, 5.47; S, 18.65
II-5F-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, 10.2 Hz), 1.10 and 1.22 (3H, s), 1.48 (1H, m), 1.67-2.38 (7H, m), 2.60-2.80 (2H, m), 3.21 (2H, br s), 4.18 (2H, d, $J = 0.9$ Hz), 4.22 (1H, m), 6.08 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.79 (1H, dt, $J = 0.9, 3.6$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 1.5, 5.1$ Hz), 7.05 (1H, m), 7.27-7.33 (2H, m); IR (CHCl_3) 2923, 1710, 1643, 1543, 1508, 1471, 1286, 1221, 1205 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26} +30.3 \pm 1.4^\circ$ ($c=0.508\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 59.12; H, 6.34; N, 3.00; S, 20.59 実測値 (%) C, 59.10; H, 6.31; N, 3.09; S, 20.47

表 4 8

化合物番号	物性値
II-6A-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.88 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 and 1.21 (3H, s), 1.22-2.36 (16H, m), 2.38 (3H, s), 4.16 (1H, m), 5.98 (1H, m), 6.19 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.30 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.17 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.52 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1709, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +22.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.64; H, 6.81; N, 5.47; S, 12.52 実測値 (%): C, 58.73; H, 6.68; N, 5.45; S, 11.93.
II-6B-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 and 1.22 (3H, s), 1.55 (1H, ddd, $J = 2.4, 5.7, 13.2$ Hz), 1.84-2.50 (11H, m), 2.39 (3H, s), 4.20 (1H, m), 5.37-5.52 (2H, m), 5.99 (1H, m), 6.17-6.21 (2H, m), 7.18 (1H, dd, $J = 1.8, 6.3$ Hz), 7.31 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1711, 1657, 1529, 1504, 1392, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +44.6 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 59.50; H, 6.39; N, 5.55; S, 12.71 実測値 (%): C, 59.16; H, 6.27; N, 5.54; S, 12.44
II-7A-31a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.22-2.34 (18H, m), 4.13 (2H, s), 4.19 (1H, m), 5.92 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.22-7.35 (6H, m); IR (CHCl_3) 3516, 3450, 3431, 1709, 1641, 1545, 1506, 1469, 1456 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +20.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 71.36; H, 8.00; N, 2.97; S, 6.80 実測値 (%): C, 71.44; H, 7.99; N, 3.02; S, 6.69
II-7A-47a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.22-2.33 (18H, m), 4.19 (1H, m), 6.06 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 5.1, 3.9$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.65 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J = 5.1, 1.5$ Hz), 7.76 (1H, dd, $J = 3.6, 1.5$ Hz); IR (CHCl_3) 3516, 3446, 2679, 1709, 1657, 1529, 1504, 1402, 1336, 1153, 1095, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +25.3 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.75; H, 6.40; N, 2.65; S, 18.07 実測値 (%): C, 56.88; H, 6.43; N, 2.68; S, 17.79
II-7A-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 and 1.22 (3H, s), 1.22-2.32 (18H, m), 2.39 (3H, s), 4.18 (1H, m), 4.65 (1H, br s), 5.99 (1H, m), 6.12 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 6.9, 15.6$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.30 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1708, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +25.1 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.56; H, 7.00; N, 5.34; S, 12.23 実測値 (%): C, 59.59; H, 7.01; N, 5.33; S, 11.85.

表 4 9

化合物番号	物性値
II-7A-55e	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.93 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.10 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.32-2.34 (16H, m), 2.29 (2H, d, J = 7.5 Hz), 2.39 (3H, s), 3.28 (3H, s), 4.21 (1H, m), 6.00 (1H, m), 6.17 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.21 (1H, m), 7.19 (1H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.56 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.76 (1H, br); IR (CHCl ₃) 3386, 2927, 2862, 1718, 1651, 1531, 1506, 1398, 1375, 1344, 1159, 1053, 1020 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +20.8±0.6° (c=1.00, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₉ N ₃ O ₆ S ₃ ·0.5MeOH) 計算値 (%): C, 53.81; H, 6.73; N, 6.85; S, 15.67 実測値 (%): C, 53.91; H, 6.64; N, 7.13; S, 15.29
II-7A-55g	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.94 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.13 (3H, s), 1.25 (3H, s), 1.26-2.40 (16H, m), 2.38 (3H, s), 2.93-3.00 (2H, m), 4.28 (1H, m), 6.00 (1H, m), 6.21 (1H, t, J = 3.3 Hz), 6.43 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.17 (1H, dd, J = 3.3, 1.5 Hz), 7.42 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.56 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3426, 2626, 1639, 1533, 1508, 1375, 1222, 1216, 1205, 1184, 1160 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +22.7±0.6° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₆ N ₆ O ₃ S ₂ ·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.21; H, 6.75; N, 15.03; S, 11.43 実測値 (%): C, 56.32; H, 6.52; N, 14.80; S, 11.13
II-7A-59a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.90 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.07 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.24-2.33 (18H, m), 4.17 (1H, m), 5.91 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.00 (1H, dd, J = 5.4, 3.6 Hz), 7.05 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.26 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.28 (1H, dd, J = 3.6, 1.2 Hz), 7.42 (1H, dd, J = 5.4, 1.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3450, 3431, 2673, 1709, 1645, 1529, 1500, 1471, 1421 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +20.1±0.6° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₈ NO ₃ S ₃) 計算値 (%): C, 61.06; H, 6.76; N, 2.85; S, 19.56 実測値 (%): C, 60.86; H, 6.87; N, 2.93; S, 19.29
II-7A-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.24-2.33 (18H, m), 4.15 (2H, s), 4.19 (1H, m), 5.94 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 5.1, 1.2 Hz), 7.05 (1H, m), 7.27 (1H, dd, J = 4.8, 1.2 Hz), 7.30 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3518, 3450, 3431, 1709, 1641, 1545, 1506, 1469 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +19.2±0.6° (c=1.012, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₅ NO ₃ S ₂ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 65.67; H, 7.46; N, 2.95; S, 13.09 実測値 (%): C, 65.81; H, 7.43; N, 2.94; S, 12.99
II-7A-104a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.10 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.25-2.34 (18H, m), 4.10 (2H, s), 4.20 (1H, m), 5.95 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.70 (1H, d, J = 3.3 Hz), 6.95 (1H, dd, J = 5.1, 3.9 Hz), 7.04 (1H, dd, J = 3.9, 1.2 Hz), 7.25 (1H, d, J = 3.3 Hz), 7.36 (1H, dd, J = 5.1, 1.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3450, 3431, 1709, 1643, 1543, 1506, 1471 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +19.8±0.6° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₅ NO ₃ S ₃ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 61.53; H, 6.99; N, 2.76; S, 18.95 実測値 (%): C, 61.42; H, 6.85; N, 2.86; S, 18.89

表 5 0

化合物番号	物性値
II-7A-143a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.10 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.26-2.38 (18H, m), 4.24 (2H, s), 4.32 (1H, m), 6.11 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.19-7.28 (6H, m), 7.42 (1H, dd, J = 8.1, 7.2 Hz), 7.76 (1H, s), 8.19 (1H, d, J = 8.1 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3442, 1709, 1651, 1514, 1495, 1469 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +34.1±0.7° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C ₃₂ H ₃₉ NO ₃ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 73.73; H, 7.62; N, 2.69; S, 6.15 実測値 (%): C, 73.72; H, 7.68; N, 2.65; S, 5.88
II-7A-197a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 9.9 Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.24-2.33 (18H, m), 3.22 (2H, t, J = 8.7 Hz), 4.05 (2H, s), 4.19 (1H, m), 4.57 (2H, t, J = 8.7 Hz), 5.92 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.79 (1H, t, J = 7.2 Hz), 6.80 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.96 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.09 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.28 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3450, 3431; 2671, 1709, 1639, 1543, 1506, 1458 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.0} +17.4±0.6° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C ₃₀ H ₃₉ NO ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 69.95; H, 7.75; N, 2.72; S, 6.22 実測値 (%): C, 69.86; H, 7.65; N, 2.80; S, 6.08
II-7A-315a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, d, J = 9.9 Hz), 1.11 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.33-2.36 (16H, m), 2.3 (2H, t, J = 7.2 Hz), 4.26 (2H, s), 4.33 (1H, m), 6.12 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.00-7.23 (5H, m), 7.42 (1H, m), 7.78 (1H, s), 8.20 (1H, d, J = 7.5 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3442, 2925, 2858, 1709, 1651, 1585, 1570, 1514, 1492, 1469, 1396 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{25.5} +33.4±0.7° (c=1.00, MeOH) 元素分析 (C ₃₂ H ₃₈ FNO ₃ S·0.5MeOH) 計算値 (%): C, 70.75; H, 7.31; N, 2.54; F, 3.44; S, 5.81 実測値 (%): C, 70.85; H, 7.34; N, 2.80; F, 3.06; S, 5.66
II-7A-316a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.96 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.11 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.32-2.36 (16H, m), 2.30 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.82 (3H, s), 4.23 (2H, s), 4.33 (1H, m), 6.12 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.82-6.91 (2H, m), 7.05-7.22 (3H, m), 7.39 (1H, m), 7.78 (1H, s), 8.14 (1H, d, J = 8.1 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3442, 2925, 2858, 1709, 1651, 1601, 1514, 1493, 1468, 1439, 1394, 1246 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{26.0} +31.4±0.7° (c=1.04, MeOH) 元素分析 (C ₃₃ H ₄₁ NO ₄ S·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 72.12; H, 7.56; N, 2.55; S, 5.23 実測値 (%): C, 71.93; H, 7.73; N, 2.77; S, 5.60
II-7B-55a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.08 (3H, s), 1.15 (3H, d, J = 7.2 Hz), 1.22 (3H, s), 1.29-2.45 (17H, m), 2.39 (3H, s), 4.19 (1H, m), 5.98 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.06 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.20 (1H, dd, J = 3.3 and 3.6 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 2.4 and 3.3 Hz), 7.29 (1H, d, 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3448, 2927, 2860, 1739, 1705, 1657, 1529, 1504, 1469, 1375, 1281, 1161, 1144, 1070, 1053, 1022 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +21.4±0.6° (c=1.02, MeOH) 元素分析 (C ₂₇ H ₃₈ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 60.04; H, 7.20; N, 5.19; S, 11.87 実測値 (%): C, 60.26; H, 7.22; N, 5.28; S, 11.50

表 5 1

化合物番号	物性値
II-7E-55c	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.50-2.40 (14H, m), 2.39 (3H, s), 4.14 (1H, m), 5.24 (1H, brs), 5.33-5.50 (2H, m), 5.99 (1H, m), 5.99 (1H, brs), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.48 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.19 (1H, m), 7.39 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.55 (1H, t, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3527, 3485, 3448, 3411, 3348, 1676, 1591, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +55.5 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.70; H, 6.86; N, 8.03; S, 12.26 実測値 (%): C, 59.79; H, 6.75; N, 8.05; S, 12.14
II-7E-55e	mp 70-72 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.96 (1H, d, $J = 10.8$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.60-2.37 (14H, m), 2.41 (3H, s), 3.25 (3H, s), 4.10 (1H, m), 5.28-5.47 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.06 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.22 (1H, dd, $J = 3.3$ and 3.6 Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8$ and 3.3 Hz), 7.41 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3427, 3386, 2927, 1714, 1647, 1531, 1506, 1454, 1375, 1342, 1161, 1120, 1053, 1020 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +50.0 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.00$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{37}\text{N}_3\text{O}_6\text{S}_3 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 53.78; H, 6.32; N, 6.97; S, 15.95 実測値 (%): C, 53.89; H, 6.28; N, 7.05; S, 15.57
II-7E-55g	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.76 (1H, d, $J = 10.8$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.44-2.31 (12H, m), 2.40 (3H, s), 2.92-3.08 (2H, m), 3.98 (1H, m), 5.37-5.39 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.22 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.30 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 3.3$, 1.8 Hz), 7.41 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3151, 1639, 1533, 1508, 1375, 1184, 1160 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +40.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{34}\text{N}_6\text{O}_3\text{S}_2 \cdot 1.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.16; H, 6.52; N, 14.44; S, 10.43 実測値 (%): C, 55.44; H, 6.42; N, 14.17; S, 10.66
II-7F-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.16 or 1.18 (3H, d, $J = 4.2$ Hz), 1.22 (3H, s), 1.47-2.52 (13H, m), 2.39 (3H, s), 4.20 (1H, m), 5.38-5.41 (2H, m), 5.99 (1H, m), 6.14-6.21 (2H, m), 7.19 (1H, m), 7.31 (1H, m), 7.54 (1H, m); IR (CHCl_3) 3446, 2925, 2870, 1738, 1705, 1657, 1529, 1504, 1469, 1375, 1182, 1161, 1144, 1070, 1053, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +49.8 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.02$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.06; H, 6.87; N, 5.19; S, 11.88 実測値 (%): C, 60.03; H, 6.71; N, 5.31; S, 11.76
II-7I-1a	mp 111-115 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.22-2.40 (12H, m), 4.19 (1H, m), 5.79 (1H, br d, $J = 15.6$ Hz), 6.06 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.03 (1H, dt, $J = 7.8$, 15.6 Hz), 7.15-7.17 (2H, m), 7.27 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1695, 1654, 1529, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +20.5 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 59.50; H, 6.39; N, 5.55; S, 12.71 実測値 (%): C, 59.19; H, 6.39; N, 5.48; S, 12.39

表 5 2

化合物番号	物性値
II-7I-47a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.8$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.22-2.40 (12H, m), 4.20 (1H, m), 5.79 (1H, br d, $J = 15.6$ Hz), 5.99 (1H, m), 6.08 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 7.2, 15.6$ Hz), 7.11 (1H, dd, $J = 3.9, 5.1$ Hz), 7.33 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.65 (1H, d, $J = 3.9$ Hz) 7.70 (1H, dd, $J = 1.2, 6.0$ Hz), 7.76 (1H, dd, $J = 1.2, 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 2680, 1695, 1655, 1529, 1504, 1336, 1153, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +20.2 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.96; H, 6.04; N, 2.66; S, 18.25 実測値 (%): C, 57.07; H, 6.12; N, 2.72; S, 17.88
II-7I-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.22-2.40 (12H, m), 2.39 (3H, s), 4.20 (1H, m), 5.79 (1H, br d, $J = 15.6$ Hz), 5.99 (1H, m), 6.06 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 6.9, 15.6$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3448, 1695, 1655, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +19.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.79; H, 6.64; N, 5.36; S, 12.28 実測値 (%): C, 59.83; H, 6.40; N, 5.42; S, 12.10.
II-7I-55b	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.27-1.78 (8H, m), 1.99-2.38 (6H, m), 2.39 (3H, s), 3.72 (3H, s), 4.19 (1H, m), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6, 1.5$ Hz), 5.98 (1H, m), 6.03 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.93 (1H, dt, $J = 15.6, 6.9$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz).
II-7I-59a	mp 143-145 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 and 1.21 (3H, s), 1.24-2.40 (14H, m), 4.18 (1H, m), 5.79 (1H, br d, $J = 15.6$ Hz), 5.91 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.98-7.08 (3H, m), 7.26 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.29 (1H, dd, $J = 1.2, 3.6$ Hz), 7.42 (1H, dd, $J = 1.2, 5.4$ Hz); IR (Nujol) 3419, 3184, 1705, 1670, 1626, 1525, 1500, 1180 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{28} +12.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.007\%$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_3$) 計算値 (%): C, 61.31; H, 6.38; N, 2.86; S, 19.64 実測値 (%): C, 61.11; H, 6.41; N, 2.92; S, 19.42
II-7I-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.26-2.34 (14H, m), 4.15 (2H, s), 4.20 (1H, m), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6, 1.2$ Hz), 5.94 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.97 (1H, dd, $J = 4.8, 1.5$ Hz), 7.05 (1H, m), 7.25-7.33 (3H, m); IR (CHCl_3) 3523, 3450, 3431, 2679, 1695, 1647, 1545, 1506, 1471 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.5} +12.7 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.21; H, 6.92; N, 3.92; S, 13.39 実測値 (%): C, 65.16; H, 6.63; N, 3.76; S, 13.48

表 5 3

化合物番号	物性値
II-7I-104a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.28-2.36 (14H, m), 4.10 (2H, s), 4.21 (1H, m), 5.79 (1H, dt, $J = 15.9, 1.5$ Hz), 5.96 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.70 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.95 (1H, dd, $J = 5.1, 3.6$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 15.9, 3.6$ Hz), 7.04 (1H, dd, $J = 3.6, 1.2$ Hz), 7.25 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.37 (1H, dd, $J = 5.1, 1.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3523, 3450, 3431, 2679, 1695, 1649, 1543, 1506 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +11.0 \pm 0.7^\circ$ ($c=0.709$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.99; H, 6.68; N, 2.73; S, 19.06 実測値 (%): C, 60.69; H, 6.45; N, 3.12; S, 19.32
II-7I-126a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.27-2.31 (14H, m), 3.83 (3H, s), 4.12 (2H, m), 4.20 (1H, m), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6, 1.5$ Hz), 5.92 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.86-6.92 (2H, m), 7.02 (1H, dt, $J = 15.6, 6.9$ Hz), 7.16 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.22 (1H, dd, $J = 7.5, 1.8$ Hz), 7.27 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3451, 3433, 2679, 1695, 1647, 1504, 1288, 1248, 1223, 1213 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{27.0} +14.0 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 69.76; H, 7.55; N, 2.81; S, 6.42 実測値 (%): C, 69.50; H, 7.50; N, 2.88; S, 6.36
II-7I-197a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.26-2.36 (14H, m), 3.22 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 4.07 (2H, s), 4.19 (1H, m), 4.57 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6$ Hz, 1.5 Hz), 5.92 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.79 (1H, t, $J = 7.2$ Hz), 6.80 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.96 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 7.01 (1H, dt, $J = 15.6, 6.9$ Hz), 7.10 (1H, dd, $J = 7.2, 1.5$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3525, 3450, 3431, 2679, 1695, 1647, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +13.0 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 70.47; H, 7.37; N, 2.74; S, 6.27 実測値 (%): C, 70.48; H, 7.33; N, 2.74; S, 6.29
II-7I-239a	mp 138-140 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.87 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.07 (3H, s), 1.19 (3H, s), 1.26-2.31 (12H, m), 4.09 (2H, s), 4.20 (1H, m), 5.73 (1H, d, $J = 15.6$ Hz), 6.08 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 6.81-6.86 (2H, m), 6.96 (1H, dt, $J = 15.6, 6.9$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.45 (1H, s); IR (CHCl_3) 3342, 3246, 1720, 1701, 1593, 1545, 1520, 1456, 1377, 1203 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +13.8 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 69.07; H, 6.76; N, 2.68; S, 6.15 実測値 (%): C, 68.91; H, 6.77; N, 2.75; S, 5.99

表 5 4

化合物番号	物性値
II-7I-270a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.26-1.55 (6H, m), 1.62-1.82 (2H, m), 1.96-2.38 (6H, m), 2.42 (6H, s), 4.20 (1H, m), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6, 1.5$ Hz), 5.88 (2H, s), 6.06 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 15.6, 6.6$ Hz), 7.27 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3525, 3448, 2679, 1695, 1655, 1529, 1504, 1375, 1180, 1119 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +19.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.47; H, 6.84; N, 5.22; S, 11.96 実測値 (%): C, 60.41; H, 6.77; N, 5.25; S, 11.90
II-7I-327a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.07 and 1.21 (3H, s), 1.25-2.38 (12H, m), 3.00 (2H, t, $J = 8.4$ Hz), 3.99 (2H, t, $J = 8.4$ Hz), 4.17 (1H, m), 5.78 (1H, dt, $J = 1.8, 15.9$ Hz), 6.02 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.97-7.24 (4H, m), 7.27 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 8.1$ Hz); IR (CHCl_3) 2927, 1695, 1653, 1529, 1504, 1479, 1367, 1165 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{26} +21.3 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.008\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 61.76; H, 6.58; N, 4.97; S, 11.37 実測値 (%) C, 61.68; H, 6.43; N, 5.02; S, 11.40
II-7I-332a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.07 and 1.22 (3H, s), 1.30-2.40 (16H, m), 2.54 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.84-3.89 (2H, m), 4.19 (1H, m), 5.79 (1H, br d, $J = 14.4$ Hz), 6.01 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.97-7.27 (5H, m), 7.78 (1H, d, $J = 8.4$ Hz); IR (CHCl_3) 2929, 1695, 1653, 1529, 1502, 1363, 1211, 1161 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +19.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.010\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{38}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 62.54; H, 6.75; N, 4.86; S, 11.13 実測値 (%) C, 62.56; H, 6.76; N, 4.87; S, 10.90
II-7I-343a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.11 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.39-2.39 (14H, m), 4.29 (1H, m), 5.78 (1H, d, $J = 15.6$ Hz), 6.15 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.02 (1H, m), 7.44-7.64 (4H, m), 7.85 (1H, s), 8.02-8.12 (3H, m), 8.65 (1H, d, $J = 6.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3523, 3444, 2925, 2862, 1695, 1653, 1516, 1493, 1471, 1446, 1419, 1383, 1315 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25.0} +34.8 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.03$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.99; H, 6.30; N, 2.44; S, 11.19 実測値 (%): C, 64.97; H, 6.26; N, 2.62; S, 10.86
II-7I-389a	mp 119-121 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.33-1.50 (6H, m), 1.63-1.78 (2H, m), 1.98 (1H, m), 2.18 (1H, m), 2.23 (3H, s), 2.12-2.32 (5H, m), 3.21 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 4.18 (1H, m), 4.62 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.79 (1H, d, $J = 15.6$ Hz), 5.95 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.90 (1H, s), 6.95 (1H, s), 7.02 (1H, dd, $J = 15.6, 6.9$ Hz), 7.09 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.30 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (Nujol) 3361, 2671, 1695, 1649, 1604, 1583, 1533, 1504, 1415, 1323, 1203 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +9.7 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.012$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 66.54; H, 6.92; N, 2.59; S, 11.84 実測値 (%): C, 66.42; H, 6.99; N, 2.52; S, 11.92

表 5 5

化合物番号	物性値
II-7I-391a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.33-1.52 (6H, m), 1.67-1.77 (2H, m), 2.00 (1H, m), 2.12 (1H, m), 2.18-2.25 (3H, m), 2.32 (3H, s) + 2.32 (1H, m), 3.19 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 4.20 (1H, m), 4.73 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.79 (1H, dt, $J = 15.6, 1.5$ Hz), 6.89 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.03 (1H, dt, $J = 15.6, 7.1$ Hz), 7.21 (1H, s), 7.35 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.51 (1H, s), 7.74 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3523, 3448, 2681, 1695, 1652, 1527, 1502, 1481, 1329 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +17.1 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{NO}_6\text{S}_2 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 62.04; H, 6.60; N, 2.41; S, 11.07 実測値 (%): C, 62.16; H, 6.52; N, 2.37; S, 10.85
II-7J-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.24-2.34 (14H, m), 1.78 (3H, d, $J = 1.2$ Hz), 2.38 (3H, d, $J = 1.2$ Hz), 4.19 (1H, s), 5.98 (1H, m), 6.04 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.19 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 6.85 (1H, dt, $J = 7.2, 1.2$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 3.3$ Hz, 1.2 Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3525, 3446, 2667, 1685, 1657, 1529, 1504, 1375, 1281, 1182, 1161, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24.0} +11.5 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.06; H, 6.87; N, 5.19; S, 11.67 実測値 (%): C, 60.15; H, 6.56; N, 5.00; S, 11.37
II-7K-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.24-2.40 (14H, m), 2.12 (3H, d, $J = 1.2$ Hz), 2.39 (3H, d, $J = 1.2$ Hz), 4.20 (2H, s), 5.64 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 5.99 (1H, m), 6.04 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 3.3, 1.8$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3523, 3446, 2575, 1689, 1655, 1530, 1504, 1375, 1182, 1161, 1053, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26.5} +18.3 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.27; H, 6.86; N, 5.20; S, 11.92 実測値 (%): C, 60.23; H, 6.66; N, 5.17; S, 11.73
II-7L-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.00 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.26-2.61 (14H, m), 2.39 (3H, s), 4.18 (1H, m), 5.95-6.08 (2H, m), 6.16-6.21 (2H, m), 7.19 (1H, m), 7.32 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3510, 3446, 2927, 2862, 1709, 1658, 1529, 1504, 1441, 1375 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0} +18.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.00$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.23; H, 6.28; N, 5.13; F, 3.48; S, 11.75 実測値 (%): C, 57.44; H, 6.31; N, 5.10; F, 3.28; S, 11.27
II-7M-1a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.23 (3H, s), 1.35-2.40 (12H, m), 3.54 (2H, t, $J = 6.0$ Hz), 4.04 (2H, s), 4.21 (1H, m), 6.10 (1H, d, $J = 9.6$ Hz), 6.32-6.35 (2H, m), 7.15-7.18 (2H, m), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 3431, 1780, 1732, 1657, 1529, 1504, 1456, 1385, 1192, 1167, 1124, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.5} +22.0 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.08; H, 6.39; N, 5.45; S, 12.48 実測値 (%): C, 56.19; H, 6.39; N, 5.48; S, 12.33

表 5 6

化合物番号	物性値
II-7M-1e	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.26-2.34 (12H, m), 3.32 (3H, s), 3.51 (2H, d, $J = 6.3$ Hz), 3.99 (2H, s), 4.20 (1H, m), 6.11 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.34 (2H, m), 7.17 (2H, m), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 8.90 (1H, s); IR (CHCl_3) 3448, 3352, 2925, 2870, 1730, 1657, 1529, 1504, 1471, 1456, 1423, 1402, 1387, 1354, 1167, 1151, 1120, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +18.7 \pm 1.1^\circ$ ($c=0.52$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{35}\text{N}_3\text{O}_7\text{S}_3 \cdot 0.7\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 50.75; H, 6.26; N, 6.91; S, 15.82 実測値 (%): C, 50.76; H, 5.68; N, 6.94; S, 15.49
II-7M-1k	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.11 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.39-2.33 (12H, m), 3.46 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.85 (2H, s), 4.22 (1H, m), 6.12 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.33 (2H, m), 7.15 (2H, m), 7.29 (1H, m), 7.52-7.66 (4H, m), 8.09 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 9.03 (1H, s); IR (CHCl_3) 3446, 3350, 2924, 2870, 1732, 1657, 1529, 1504, 1473, 1450, 1415, 1385, 1167, 1120, 1088, 1057, 1034 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +14.9 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.00$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{N}_3\text{O}_7\text{S}_3 \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 54.71; H, 5.85; N, 6.38; S, 14.61 実測値 (%): C, 54.81; H, 5.76; N, 6.60; S, 14.29
II-7M-31a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.21 (3H, s), 1.39-2.37 (12H, m), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.03 and 4.14 (2H, s), 4.23 (1H, m), 6.00 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.20-7.37 (6H, m); IR (CHCl_3) 2923, 1780, 1732, 1641, 1545, 1508, 1471, 1456, 1365, 1248, 1219, 1211, 1207, 1124 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +14.9 \pm 1.1^\circ$ ($c=0.509\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 68.27; H, 7.55; N, 2.95; S, 6.75 実測値 (%) C, 68.25; H, 7.62; N, 3.02; S, 6.76
II-7M-40a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.15 and 1.25 (3H, s), 1.21-2.38 (12H, m), 3.54 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.05 (2H, s), 4.28 (1H, m), 6.11 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.25-7.64 (7H, m); IR (CHCl_3) 2924, 1780, 1732, 1641, 1541, 1510, 1491, 1471, 1454, 1219, 1211 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +15.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.010\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 67.74; H, 7.35; N, 3.04; S, 6.96 実測値 (%) C, 67.68; H, 7.26; N, 3.107; S, 6.75
II-7M-43a	mp 95-97 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.94 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.14 and 1.24 (3H, s), 1.24-2.38 (12H, m), 3.54 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.05 (2H, s), 4.27 (1H, m), 6.07 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.04 (1H, dd, $J = 3.9, 4.8$ Hz), 7.11 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.24 (1H, dd, $J = 1.2, 3.6$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J = 1.2, 5.1$ Hz), 7.37 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3346, 2927, 1759, 1728, 1612, 1525, 1504, 1458, 1377, 1132 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +18.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.011\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.8\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 60.55; H, 6.90; N, 2.94; S, 13.47 実測値 (%) C, 60.35; H, 6.61; N, 3.07; S, 13.43

表 5 7

化合物番号	物性値
II-7M-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.10 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.40 (12H, m), 3.53 (2H, t, J = 6.0 Hz), 4.05 (2H, s), 4.21 (1H, m), 6.14 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 0.9, 4.8 Hz), 7.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.64 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.76 (1H, dd, J = 1.2, 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3446, 3429, 1780, 1732, 1655, 1529, 1504, 1336, 1153, 1124, 1074, 1024 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +22.5±0.6° (c=1.013, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₁ NO ₆ S ₃ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.09 H, 6.01; N, 2.63; S, 18.05 実測値 (%): C, 54.29; H, 5.90; N, 2.81; S, 17.77
II-7M-55a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 and 1.23 (3H, s), 1.35-2.40 (12H, m), 2.39 (3H, s), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.04 (2H, s), 4.21 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.12 (1H, d, J = 9.6 Hz), 6.20 (1H, t, J = 3.3 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 1.5, 3.3 Hz), 7.32 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3446, 1780, 1731, 1656, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1142, 1053 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +20.9±0.6° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C ₂₅ H ₃₄ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.86 H, 6.60; N, 5.30; S, 12.14 実測値 (%): , 56.88; H, 6.60; N, 5.31; S, 11.76
II-7M-59a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.38 (12H, m), 3.53 (2H, t, J = 6.0 Hz), 4.04 (2H, s), 4.21 (1H, m), 5.98 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.01 (1H, dd, J = 3.6, 5.4 Hz), 7.05 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.27 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.29 (1H, dd, J = 1.2, 3.6 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 1.5, 5.4 Hz); IR (CHCl ₃) 3448, 3429, 1780, 1732, 1645, 1529, 1500, 1471, 1458, 1124 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +17.1±0.9° (c=0.608%, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₁ NO ₄ S ₃ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.75 H, 6.38; N, 2.81; S, 19.27 実測値 (%): C, 57.86; H, 6.39; N, 2.89; S, 19.18
II-7M-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.11 and 1.22 (3H, s), 1.42-2.38 (12H, m), 3.53 (2H, t, J = 6.0 Hz), 4.03 and 4.16 (2H, s), 4.24 (1H, m), 6.01 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.79 (1H, d, J = 2.7 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.05 (1H, m), 7.26-7.33 (2H, m); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1641, 1545, 1508, 1471, 1221, 1219, 1211, 1207, 1124 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +15.5±1.1° (c=0.505%, MeOH); 元素分析 (C ₂₅ H ₃₃ NO ₄ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%) C, 62.42; H, 7.04; N, 2.91; S, 13.33 実測値 (%) C, 62.57; H, 7.03; N, 2.98; S, 13.15
II-7M-126a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.45-2.33 (12H, m), 3.51 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.84 (3H, s), 4.02 (2H, s), 4.11 (2H, s), 4.22 (1H, m), 5.99 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.86-6.92 (2H, m), 7.15 (1H, dd, J = 7.2, 1.8 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 4.8, 1.8 Hz), 7.29 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3431, 1669, 1506, 1463, 1247, 1128 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{27.0} +14.4±0.5° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C ₂₈ H ₃₇ NO ₅ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 66.82; H, 7.49; N, 2.78; S, 6.37 実測値 (%): C, 66.59; H, 7.41; N, 2.82; S, 6.17

表 5 8

化合物番号	物性値
II-7M-197a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 and 1.21 (3H, s), 1.39-2.38 (12H, m), 3.22 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.02 and 4.07 (2H, s), 4.23 (1H, m), 4.58 (2H, t, $J = 9.0$ Hz), 6.00 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.80-7.12 (4H, m), 7.30 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 2923, 1780, 1732, 1639, 1545, 1506, 1477, 1458, 1441, 1365, 1254, 1205, 1126 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +13.4 \pm 1.1^\circ$ ($c=0.506\%$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 67.13; H, 7.34; N, 2.70; S, 6.18 実測値 (%) C, 67.19; H, 7.21; N, 2.75; S, 6.18
II-7M-239a	mp 179-180 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.78 (1H, d, $J = 9.6$ Hz), 1.05 (3H, s), 1.13 (3H, s), 1.20-2.30 (12H, m), 3.40 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 3.84 (1H, m), 3.93 (2H, s), 4.17 (2H, s), 6.73 (1H, dd, $J = 8.7, 2.4$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 2.4$ Hz), 6.95 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.34 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.66 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.79 (1H, d, $J = 6.9$ Hz), 7.82 (1H, s); IR (KBr) 3338, 3244, 2602, 1739, 1606, 1557, 1550, 1525, 1458, 1367, 1261, 1211 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0} +14.0 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_6\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.59; H, 6.76; N, 2.36; S, 6.04 実測値 (%): C, 65.62; H, 6.82; N, 2.81; S, 5.92
II-7M-270a	mp 147-149 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.34-2.38 (12H, m), 2.42 (6H, s), 3.54 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.05 (2H, s), 4.21 (1H, m), 5.88 (2H, s), 6.12 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3267, 3099, 2549, 1726, 1610, 1562, 1230, 1211, 1176, 1126, 1113 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +19.8 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 58.18; H, 6.76; N, 5.22; S, 11.95 実測値 (%): C, 58.05; H, 6.74; N, 5.16; S, 11.71
II-7M-307a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.06 (3H, s), 1.19 (3H, s), 1.38-1.79 (8H, m), 1.96 (1H, m), 2.06 (1H, m), 2.15-2.31 (2H, m), 3.49 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 3.99 (3H, s), 4.20 (1H, m), 4.60 (2H, s), 5.95 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.74 (1H, br d, $J = 3.6$ Hz), 7.22 (1H, d, $J = 3.6$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 7.34 (1H, ddd, $J = 1.5, 6.9, 8.4$ Hz), 7.47 (1H, ddd, $J = 1.5, 6.9, 8.4$ Hz), 7.80 (1H, br d, $J = 8.4$ Hz), 7.82 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 7.93 (1H, br d, $J = 8.4$ Hz); IR (Nujol) 3450, 3060, 1780, 1732, 1639, 1597, 1510, 1471, 1265, 1252, 1217 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0} +16.1 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{39}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 69.01; H, 7.20; N, 2.51; S, 5.76 実測値 (%): C, 68.97; H, 7.13; N, 2.56; S, 5.62

表 5 9

化合物番号	物性値
II-7M-327a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.07 and 1.21 (3H, s), 1.36-2.35 (12H, m), 3.01 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.52 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.99 (2H, t, J = 8.4 Hz), 4.03 (2H, s), 4.19 (1H, m), 6.09 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.99-7.24 (3H, m), 7.29 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.47 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 8.1 Hz); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1529, 1504, 1479, 1460, 1367, 1240, 1225, 1213, 1205, 1165, 1122, 1105 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +22.2±0.6° (c=1.009%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₆ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.5H ₂ O) 計算値 (%) C, 59.03; H, 6.55; N, 4.92; S, 11.26 実測値 (%) C, 58.93; H, 6.75; N, 5.14; S, 11.27
II-7M-329a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.08 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.38 (12H, m), 3.04 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.04 (2H, s); 4.04 (2H, t, J = 8.4 Hz), 4.20 (1H, m), 6.11 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.75 (1H, m), 7.20 (1H, m), 7.30 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.37 (1H, br d, J = 7.5 Hz), 7.49 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1626, 1529, 1504, 1473, 1460, 1369, 1244, 1223, 1213, 1167 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +21.4±0.6° (c=1.009%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₅ FN ₂ O ₆ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 57.40; H, 6.16; F, 3.24; N, 4.78; S, 10.95 実測値 (%) C, 57.37; H, 5.82; F, 3.06; N, 4.86; S, 10.80
II-7M-330a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.08 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.39 (12H, m), 2.97 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.02 (2H, t, J = 8.7 Hz), 4.04 (2H, s), 4.19 (1H, m), 6.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.82-6.94 (2H, m), 7.44 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.53 (1H, dd, J = 4.5, 8.7 Hz); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1529, 1504, 1481, 1367, 1225, 1165 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +21.7±0.6° (c=1.008%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₅ FN ₂ O ₆ S ₂ ·0.5H ₂ O) 計算値 (%) C, 57.22; H, 6.17; F, 3.23; N, 4.77; S, 10.91 実測値 (%) C, 57.26; H, 6.14; F, 3.19; N, 4.85; S, 10.76
II-7M-331a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.5 Hz), 1.08 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.38 (12H, m), 3.04 (2H, t, J = 8.4 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.04 (2H, s), 4.04 (2H, t, J = 8.4 Hz), 4.20 (1H, m), 6.11 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.75 (1H, m), 7.20 (1H, m), 7.30 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.37 (1H, br d, J = 7.5 Hz), 7.49 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1606, 1529, 1492, 1369, 1261, 1227, 1205, 1165, 1142, 1095 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +21.4±0.6° (c=1.009%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₅ FN ₂ O ₆ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%) C, 57.57; H, 6.14; F, 3.25; N, 4.80; S, 10.98 実測値 (%) C, 57.28; H, 5.85; F, 3.20; N, 4.86; S, 10.97

表 6 0

化合物番号	物性値
II-7M-332a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.08 and 1.23 (3H, s), 1.36-2.40 (14H, m), 2.55 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.53 (2H, t, J = 6.6 Hz), 3.84-3.87 (2H, m), 4.05 (2H, s), 4.20 (1H, m), 6.05 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.04-7.27 (5H, m), 7.78 (1H, dd, J = 0.9, 8.1 Hz); IR (CHCl ₃) 2925, 1780, 1732, 1655, 1529, 1504, 1489, 1363, 1236, 1225, 1213, 1207, 1161, 1122 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +19.5±0.6° (c=1.015%, MeOH); 元素分析 (C ₂₉ H ₃₈ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 59.85; H, 6.72; N, 4.81; S, 11.02 実測値 (%) C, 59.84; H, 6.75; N, 4.92; S, 11.16
II-7M-333a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.08 and 1.23 (3H, s), 1.36-2.40 (12H, m), 3.53 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.87-3.96 (4H, m), 4.05 (2H, s), 4.20 (1H, m), 6.09 (1H, d, J = 9.0 Hz), 6.85 (1H, dd, J = 1.5, 8.4 Hz), 6.96 (1H, m), 7.11 (1H, m), 7.26-7.30 (2H, m), 7.83 (1H, dd, J = 1.5, 8.1 Hz); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1529, 1502, 1491, 1367, 1248, 1215, 1207, 1165, 1126 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁸ +20.5±0.6° (c=1.004%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₆ N ₂ O ₇ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 57.59; H, 6.35; N, 4.80; S, 10.98 実測値 (%) C, 57.59; H, 6.24; N, 4.89; S, 10.78
II-7M-334a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.08 and 1.23 (3H, s), 1.36-2.40 (12H, m), 3.05 (2H, dd, J = 5.4, 9.0 Hz), 3.54 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.03-4.07 (4H, m), 4.21 (1H, m), 6.07 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.09-7.27 (5H, m), 7.67 (1H, m); IR (CHCl ₃) 2924, 1780, 1732, 1655, 1529, 1504, 1473, 1363, 1161 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +24.4±0.6° (c=1.013%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₆ N ₂ O ₆ S ₃ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 56.05; H, 6.18; N, 4.67; S, 16.03 実測値 (%) C, 56.18; H, 6.09; N, 4.69; S, 15.74
II-7M-336a	mp 166-168 °C; ¹ H-NMR (d6-DMSO) δ 0.79 (1H, d, J = 9.6 Hz), 1.03 and 1.22 (3H, s), 1.22-1.58 (8H, m), 1.91 (1H, m), 2.08-2.30 (4H, m), 3.39 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.85 (1H, m), 3.92 (2H, s), 4.63 (4H, s), 7.20-7.35 (4H, m), 7.77 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.24 (1H, d, J = 6.9 Hz); IR (Nujol) 3369, 3093, 2924, 1730, 1612, 1541, 1516, 1466, 1377, 1344, 1215, 1165, 1126, 1084 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +19.0±0.6° (c=1.003%, MeOH); 元素分析 (C ₂₈ H ₃₆ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.7H ₂ O) 計算値 (%) C, 58.66; H, 6.57; N, 4.89; S, 11.19 実測値 (%) C, 58.38; H, 6.40; N, 4.99; S, 11.48
II-7M-343a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.94 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.11 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.44-2.36 (12H, m), 3.49 (2H, t, J = 6.9 Hz), 3.99 (2H, t, J = 6.9 Hz), 4.29 (1H, m), 6.27 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.44-7.63 (4H, m), 7.89 (1H, s), 8.01-8.11 (3H, m), 8.63 (1H, d, J = 7.5 Hz); IR (CHCl ₃) 3442, 2924, 2870, 1780, 1730, 1653, 1518, 1417, 1446, 1383, 1317 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{26.0} +24.3±0.6° (c=1.01, MeOH) 元素分析 (C ₃₀ H ₃₆ N ₂ O ₆ S ₂ ·1.7H ₂ O) 計算値 (%) C, 60.02; H, 6.45; N, 2.33; S, 10.68 実測値 (%) C, 60.14; H, 6.18; N, 2.40; S, 10.3

表 6 1

化合物番号	物性値
II-7M-385a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.96 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.16 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.37-2.39 (12H, m), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.02 (2H, s), 4.35 (1H, m), 6.26 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 6.48 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.21 (2H, t, $J = 2.4$ Hz), 7.57-7.59 (2H, m), 8.39 (1H, m), 8.44 (1H, s); IR (CHCl_3) 3456, 3103, 3022, 2924, 1732, 1651, 1516, 1371, 1221, 1188, 1163, 1057 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{22.0} +42.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.00; H, 6.15; N, 5.00; S, 11.44 実測値 (%): C, 59.85; H, 6.29; N, 4.82; S, 11.28
II-7M-389a	mp 112-114 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.39-1.52 (4H, m), 1.59-1.81 (4H, m), 1.98 (1H, m), 2.11 (1H, m), 2.23 (3H, s) + 2.18-2.34 (2H, m), 3.21 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.52 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 4.05 (2H, s), 4.20 (1H, m), 4.62 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 6.00 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.90 (1H, s), 6.96 (1H, s), 7.08 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (Nujol) 3406, 3338, 2729, 1757, 1738, 1614, 1583, 1533, 1503, 1203, 1124 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +12.2 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.64; H, 6.89; N, 2.56; S, 11.72 実測値 (%): C, 63.68; H, 6.83; N, 2.55; S, 11.54
II-7M-390a	mp 120-122 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.38-1.52 (4H, m), 1.56-1.78 (4H, m), 1.98 (1H, m), 2.10 (1H, m), 2.17-2.33 (2H, m), 2.39 (3H, s), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.04 (2H, s), 4.20 (1H, m), 6.00 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.72 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.09 (1H, m), 7.18 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.33 (1H, m) + 7.34 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.63 (1H, d, $J = 2.1$ Hz); IR (CHCl_3) 3508, 3448, 3429, 2667, 2568, 1780, 1732, 1645, 1529, 1500, 1471, 1421, 1323, 1246, 1130, cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +12.5 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.66; H, 6.56; N, 2.56; S, 11.72 実測値 (%): C, 63.74; H, 6.44; N, 2.54; S, 11.78
II-7M-391a	mp 177-179 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 (3H, s), 1.22 (3H, s), 1.40-1.53 (4H, m), 1.57-1.71 (3H, m), 1.79 (1H, m), 2.00 (1H, m), 2.11 (1H, m), 2.19-2.35 (2H, m) + 2.32 (3H, s), 3.19 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.53 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 4.05 (2H, s), 4.21 (1H, m), 4.73 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 6.17 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.21 (1H, s), 7.36 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.51 (1H, s), 7.74 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3249, 2754, 2677, 2553, 1736, 1622, 1564, 1331, 1225, 1196, 1155, 1134 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +17.1 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_7\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.12; H, 6.51; N, 2.42; S, 11.07 実測値 (%): C, 60.09; H, 6.47; N, 2.32; S, 11.06

表 6 2

化合物番号	物性値
II-7M-392a	mp 155-156 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.89 (1H, d, $J = 9.9$ Hz), 1.08 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.36-1.52 (4H, m), 1.55-1.69 (3H, m), 1.78 (1H, m), 1.99 (1H, m), 2.10 (1H, m), 2.17-2.34 (2H, m), 2.51 (3H, s), 3.51 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 4.04 (2H, s), 4.19 (1H, m), 6.17 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.78 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.36 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.64 (1H, m), 7.75 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.77 (1H, m), 7.83 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3323, 1734, 1624, 1536, 1321, 1153, 1126 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{25} +20.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_7\text{S}_2 \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.59; H, 6.24; N, 2.40; S, 10.97 実測値 (%): C, 59.57; H, 6.12; N, 2.37; S, 10.77
II-7M-393a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.90 (3H, t, $J = 7.2$ Hz), 0.91 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.25-1.79 (12H, m), 1.98 (1H, m), 2.10 (1H, m), 2.17-2.34 (2H, m), 2.47 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 3.23 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.52 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 4.04 (2H, s), 4.21 (1H, m), 4.62 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.99 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.93 (1H, s), 6.98 (1H, s), 7.07 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.31 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3058, 3448, 3429, 1780, 1732, 1643, 1529, 1500, 1466, 1419, 1248, 1124 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +12.7 \pm 0.5^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{43}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.21; H, 7.42; N, 2.38; S, 10.88 実測値 (%): C, 65.09; H, 7.37; N, 2.35; S, 11.02
II-7N-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.08 and 1.23 (3H, s), 1.56 (1H, ddd, $J = 2.7, 6.0, 13.5$ Hz), 1.90-2.46 (7H, m), 2.39 (3H, s), 4.11 (2H, d, $J = 1.2$ Hz), 4.14-4.19 (3H, m), 5.57-5.76 (2H, m), 5.99 (1H, m), 6.17-6.21 (2H, m), 7.19 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.34 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1732, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1142, 1119, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +40.4 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.08; H, 6.25; N, 5.32; S, 12.19 実測値 (%): C, 57.07; H, 6.18; N, 5.39; S, 11.91
II-7O-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.09 and 1.23 (3H, s), 1.55 (1H, ddd, $J = 2.7, 5.7, 13.5$ Hz), 1.85-2.40 (7H, m), 2.39 (3H, s), 3.93-4.05 (4H, m), 4.25 (1H, m), 5.58-5.79 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.11 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 6.20 (1H, t, $J = 3.3$ Hz), 7.19 (1H, dd, $J = 1.5, 3.3$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (CHCl_3) 3444, 1778, 1732, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24.5} +15.8 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.88; H, 6.26; N, 5.31; S, 12.15 実測値 (%): C, 56.91; H, 6.17; N, 5.30; S, 12.14

表 6 3

化合物番号	物性値
II-7P-55a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.89 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.54 (1H, m), 1.95-2.35 (7H, m), 2.39 (3H, s), 4.14-4.31 (5H, m), 5.39 (1H, dt, J = 7.8 Hz and 20.7 Hz), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, m), 6.29 (1H, d, J = 5.4 Hz), 7.18 (1H, m), 7.36 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.53 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3446, 2925, 1732, 1655, 1531, 1504, 1375, 1161, 1142, 1053, 1022 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +30.1±0.7° (c=1.01, MeOH) 元素分析 (C ₂₅ H ₃₁ FN ₂ O ₆ S ₂ ·0.7MeOH) 計算値 (%): C, 55.01; H, 6.07; N, 4.99; F, 3.39; S, 11.43 実測値 (%): C, 55.21; H, 5.92; N, 5.11; F, 3.49; S, 11.16
II-7P-55e	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.10 (3H, s), 1.25 (3H, s), 1.97-2.37 (8H, m), 2.39 (3H, s), 3.28 (3H, s), 3.99-4.28 (5H, m), 5.41 (1H, dt, J = 8.7 and 20.4 Hz), 5.99 (1H, m), 6.13 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.20 (1H, m), 7.19 (1H, m), 7.33 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.55 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3448, 3352, 2925, 1728, 1657, 1529, 1504, 1425, 1402, 1375, 1348, 1157, 1053, 1020 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +32.7±1.5° (c=0.49, MeOH) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₄ FN ₃ O ₇ S ₃ ·0.45MeOH) 計算値 (%): C, 50.41; H, 5.73; N, 6.67; F, 3.01; S, 15.26 実測値 (%): C, 50.80; H, 5.81; N, 6.63; F, 2.85; S, 14.87
II-7P-55j	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.90 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.51-2.37 (8H, m), 2.39 (3H, s), 3.97 (2H, s), 4.17-4.25 (3H, m), 5.39 (1H, dt, J = 9.0 and 20.7 Hz), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, m), 6.37 (1H, d, J = 8.1 Hz), 6.71 (1H, s), 7.19 (1H, m), 7.39 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3519, 3402, 2925, 2870, 1745, 1689, 1657, 1574, 1529, 1504, 1471, 1448, 1375, 1161, 1144, 1092, 1053, 1022 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁵ +40.8±1.6° (c=0.51, MeOH)
II-7Q-55a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.90 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.11 and 1.23 (3H, s), 1.53 (1H, ddd, J = 2.1, 5.7, 13.5 Hz), 1.70-2.38 (7H, m), 2.38 (3H, s), 3.52 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.96-4.13 (2H, m), 4.23 (1H, m), 5.97-6.04 (2H, m), 6.14 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.20 (1H, t, J = 3.6 Hz), 6.96 (1H, dt, J = 4.2, 15.6 Hz), 7.18 (1H, m), 7.27 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.54 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 2925, 1701, 1657, 1529, 1504, 1375, 1215, 1182, 1161, 1142 cm ⁻¹ ; [α] ₈₈₅ ²⁶ -42.1±0.8° (c=1.001%, MeOH); 元素分析 (C ₂₅ H ₃₂ N ₂ O ₆ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%) C, 56.88; H, 6.26; N, 5.31; S, 12.15 実測値 (%) C, 56.95; H, 6.11; N, 5.35; S, 12.11
II-7R-55a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.92 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.09 and 1.22 (3H, s), 1.35-2.40 (12H, m), 2.39 (3H, s), 2.64 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.20 (2H, s), 4.20 (1H, m), 4.52 (1H, br s), 5.99 (1H, m), 6.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.20 (1H, t, J = 3.3 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 1.8, 3.3 Hz), 7.31 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3446, 2675, 2565, 1711, 1657, 1529, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +23.5±0.6° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C ₂₅ H ₃₄ N ₂ O ₅ S ₃ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.18; H, 6.41; N, 5.15; S, 17.68 実測値 (%): C, 55.29; H, 6.31; N, 5.12; S, 17.46

表 6 4

化合物番号	物性値
II-7R-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.93 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.10 and 1.22 (3H, s), 1.36-2.40 (12H, m), 2.65 (2H, t, $J = 6.9$ Hz), 3.17 and 3.22 (each 1H, ABq, $J = 14.7$ Hz), 4.16 (2H, s), 4.23 (1H, m), 4.60 (1H, br s), 6.04 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.79 (1H, br d, $J = 3.9$ Hz), 6.96 (1H, dd, $J = 1.5, 5.1$ Hz), 7.05 (1H, m), 7.28 (1H, dd, $J = 3.0, 4.8$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 3.6$ Hz); IR (CHCl_3) 3450, 3430, 1711, 1641, 1545, 1508, 1471, 1460, 1294, 1263, 1126 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +18.0 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.40; H, 6.81; N, 2.82; S, 19.35 実測値 (%): C, 60.42; H, 6.60; N, 2.99; S, 19.47
II-7R-270a	mp. 150-152°C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, $J = 10.5$ Hz), 1.09 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.34-2.38 (12H, m), 2.42 (6H, s), 2.64 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.20 (2H, s), 4.21 (1H, m), 5.88 (2H, s), 6.15 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 3.9$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 3.9$ Hz); IR (Nujol) 3365, 3084, 1709, 1622, 1549, 1367, 1176, 1126 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{27} +22.7 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_3 \cdot 0.2(\text{C}_6\text{H}_{14}\text{O})$) 計算値 (%): C, 57.31; H, 6.86; N, 4.91; S, 16.88 実測値 (%): C, 57.18; H, 6.78; N, 4.89; S, 16.95
II-7S-47a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.86 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 and 1.20 (each 3H, s), 1.38-2.40 (10H, m), 3.89-4.20 (4H, m), 6.68-6.72 (2H, d, m), 7.11 (1H, dd, $J = 3.6, 4.8$ Hz), 7.44 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.71 (1H, dd, $J = 3.6, 5.1$ Hz), 7.74 (1H, dd, $J = 1.2, 3.9$ Hz); IR (CHCl_3) 3346, 3097, 1730, 1649, 1533, 1506, 1402, 1335, 1153, 1024 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +27.5 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_3 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 52.63; H, 5.70; N, 5.11; S, 17.56 実測値 (%): C, 52.45; H, 5.39; N, 5.211; S, 17.62
II-7S-55a	mp 99-101 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.87 (1H, d, $J = 10.2$ Hz), 1.08 and 1.21 (each 3H, s), 1.40-2.40 (10H, m), 2.38 (3H, s), 3.91-4.20 (3H, m), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, t, $J = 3.6$ Hz), 6.53-6.60 (2H, d, m), 7.17 (1H, dd, $J = 1.8, 3.3$ Hz), 7.41 (1H, d, $J = 4.2$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 4.2$ Hz); IR (Nujol) 3321, 3089, 1736, 1709, 1660, 1633, 1550, 1377, 1236, 1184, 1159, 1051 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +28.5 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{N}_3\text{O}_6\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 56.05; H, 6.21; N, 7.84; S, 11.97 実測値 (%): C, 55.74; H, 6.17; N, 7.71; S, 11.81

表 6 5

化合物番号	物性値
II-7T-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.86 (1H \times 1/2, d, J = 10.5 Hz), 0.90 (1H \times 1/2, d, J = 10.5 Hz), 1.05, 1.08, 1.20 and 1.22 (each 3H \times 1/2, s), 1.40-2.57 (10H, m), 2.39 (3H, s), 4.18 (1H, m), 4.47 and 4.57 (each 1H \times 1/2, ABq, J = 17.1 Hz), 4.49 and 4.59 (each 1H \times 1/2, ABq, J = 17.1 Hz), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, m), 6.36 (1H, m), 6.73 (1H \times 1/2, t, J = 6.0 Hz), 7.18 (1H, m), 7.32 (1H \times 1/2, d, J = 3.9 Hz), 7.38 (1H \times 1/2, d, J = 3.9 Hz), 7.46 (1H \times 1/2, t, J = 6.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl_3) 3446, 1765, 1732, 1655, 1531, 1504, 1375, 1182, 1161, 1144, 1053, 1022 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25}$ -4.2 \pm 0.4 $^\circ$ (c =1.008, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_6\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 55.26; H, 5.99; N, 8.06; S, 12.29 実測値 (%): C, 55.20; H, 5.88; N, 7.81; S, 11.94
II-7U-31a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.10 and 1.22 (3H, s), 1.47 (1H, m), 1.64-2.63 (12H, m), 4.13 (2H, s), 4.20 (1H, m), 6.07 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.22-7.36 (6H, m); IR (CHCl_3) 2924, 1709, 1643, 1543, 1506, 1471, 1454, 1284, 1223, 1213, 1205 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25}$ +25.1 \pm 1.3 $^\circ$ (c =0.507%, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}_2\cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 66.03; H, 7.31; N, 2.83; S, 13.06 実測値 (%) C, 66.03; H, 7.37; N, 2.96; S, 13.09
II-7U-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.89 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.10 and 1.22 (3H, s), 1.48 (1H, ddd, J = 2.4, 5.4, 13.2 Hz), 1.65-2.60 (12H, m), 2.40 (3H, s), 4.18 (1H, m), 5.99 (1H, m), 6.20 (1H, t, J = 3.3 Hz), 6.23 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 1.8, 3.3 Hz), 7.33 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.55 (1H, d, J = 4.2 Hz); IR (CHCl_3) 2925, 1741, 1709, 1657, 1529, 1504, 1375, 1221, 1211, 1207, 1182, 1161, 1144 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25}$ +29.1 \pm 0.7 $^\circ$ (c =1.008%, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_3\cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 55.18; H, 6.41; N, 5.15; S, 17.68 実測値 (%) C, 55.20; H, 6.25; N, 5.21; S, 17.71
II-7U-88a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.91 (1H, d, J = 10.2 Hz), 1.11 and 1.22 (3H, s), 1.47 (1H, m), 1.64-2.63 (12H, m), 4.16 (2H, s), 4.21 (1H, m), 6.08 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.79 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.05 (1H, m), 7.27-7.34 (3H, m); IR (CHCl_3) 2924, 1709, 1643, 1543, 1508, 1471, 1284, 1238, 1217 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25}$ +24.9 \pm 0.6 $^\circ$ (c =1.014%, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_3\cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) C, 60.18; H, 6.83; N, 2.81; S, 19.28 実測値 (%) C, 60.20; H, 6.77; N, 2.94; S, 19.34
II-7V-55a	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 0.92 (1H, d, J = 10.8 Hz), 1.09 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.26-2.34 (14H, m), 2.39 (3H, s), 4.20 (1H, m), 5.99-6.07 (2H, m), 6.13-6.29 (2H, m), 7.19 (1H, m), 7.29 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 3.9 Hz); IR (CHCl_3) 3512, 3446, 2927, 2862, 2553, 1711, 1658, 1529, 1504, 1431, 1375, 1279 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{25.0}$ +16.0 \pm 1.1 $^\circ$ (c =0.50, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}_2\cdot 0.6\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 57.47; H, 6.42; N, 5.04; F, 3.42; S, 11.54 実測値 (%): C, 57.77; H, 6.28; N, 4.95; F, 3.33; S, 11.15

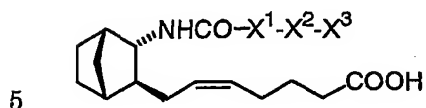
表 6 6

化合物番号	物性値
II-8C-55a	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.77 (1H, d, J = 9.6 Hz), 1.03 (3H, s), 1.12 (3H, s), 1.13-1.52 (9H, m), 1.89 (1H, m), 2.06-2.30 (4H, m), 2.32 (3H, s), 3.39 (2H, m), 3.62 (2H, s), 3.84 (1H, m), 6.10 (1H, m), 6.27 (1H, t, J = 3.3 Hz), 7.25 (1H, dd, J = 3.3, 1.5 Hz), 7.87 (1H, d, J = 3.9 Hz), 7.98 (1H, d, J = 3.9 Hz), 8.45 (1H, d, J = 7.2 Hz); IR (Nujol) 3332, 1623, 1536, 1457, 1375, 1182, 1160 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +15.1±0.6° (c=1.006, DMSO) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₆ N ₂ O ₆ S ₂ ·2.0H ₂ O) 計算値 (%): C, 53.52; H, 7.04; N, 4.89; S, 11.10 実測値 (%): C, 53.38; H, 6.74; N, 4.82; S, 10.88
II-8C-88a	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.77 (1H, d, J = 9.3 Hz), 1.05 (3H, s), 1.13 (3H, s), 1.14-1.66 (8H, m), 1.86-2.28 (6H, m), 3.38 (2H, m), 3.60 (2H, s), 3.85 (1H, m), 4.13 (2H, s), 6.88 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.99 (1H, dd, J = 5.1, 0.9 Hz), 7.28 (1H, m), 7.48 (1H, dd, J = 5.1, 3.0 Hz), 7.67 (1H, d, J = 3.6 Hz), 7.82 (1H, d, J = 7.2 Hz); IR (Nujol) 3413, 1623, 1508, 1459, 1091 cm ⁻¹ ; [α] _D ^{24.0} +12.6±1.1° (c=0.500, DMSO) 元素分析 (C ₂₆ H ₃₅ NO ₄ S ₂ ·2.0H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.40; H, 7.28; N, 2.66; S, 12.00 実測値 (%): C, 58.43; H, 7.01; N, 2.73; S, 11.73
VI-6A-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.86 (1H, m), 1.04-1.66 (15H, m), 1.95 (1H, m), 2.15 (1H, brs), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.26 (1H, m), 3.49 (1H, m), 6.11 (1H, brt), 6.33 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.16 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.33 and 7.57 (each 1H, each d, each J = 4.2 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 2679, 1709, 1658, 1535, 1509, 1456, 1385, 1274, 1192, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +8.7±0.5° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.50; H, 6.34; N, 5.83; S, 13.35 実測値 (%): C, 57.56; H, 6.46; N, 5.91; S, 13.04
VI-6A-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.87 (1H, m), 1.04-1.66 (15H, m), 1.95 (1H, m), 2.16 (1H, brs), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.27 (1H, m), 3.49 (1H, m), 6.24 (1H, brt), 7.11 (1H, dd, J = 3.6 and 4.8 Hz), 7.39 and 7.63 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.2 and 4.8 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 1.2 and 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 1709, 1657, 1533, 1506, 1402, 1336, 1153, 1097, 1024 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +7.4±0.5° (c=1.014, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₉ NO ₅ S ₃ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.93; H, 5.97; N, 2.79; S, 19.13 実測値 (%): C, 55.08; H, 6.09; N, 2.93; S, 19.03
VI-6A-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.87 (1H, m), 1.04-1.68 (15H, m), 1.94 (1H, m), 2.17 (1H, brs), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.20 (1H, m), 3.53 (1H, m), 4.15 (2H, s), 5.87 (1H, brt), 6.78 (1H, m), 6.96 (1H, dd, J = 1.2 and 5.1 Hz), 7.05 (1H, m), 7.28 (1H, dd, J = 3.0 and 5.1 Hz), 7.34 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3516, 3452, 1709, 1645, 1547, 1513, 1462 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁶ +8.4±0.5° (c=1.015, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₁ NO ₃ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 64.17; H, 7.04; N, 3.12; S, 14.28 実測値 (%): C, 64.16; H, 7.13; N, 3.18; S, 14.09

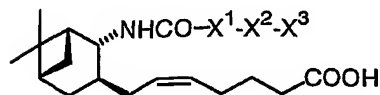
表 6 7

化合物番号	物性値
VII-6A-1a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.86 (1H, m), 1.08-1.60 (15H, m), 1.95 (1H, m), 2.15 (1H, brs), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.26 (1H, m), 3.49 (1H, m), 6.15 (1H, brt, J = 5.1 Hz), 6.33 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.16 (2H, t, J = 2.4 Hz), 7.33 and 7.57 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 2677, 1709, 1660, 1533, 1508, 1456, 1385, 1275, 1192, 1167, 1057, 1034 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ -7.6±0.5° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₃₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.07; H, 6.37; N, 5.79; S, 13.25 実測値 (%): C, 57.16; H, 6.27; N, 5.81; S, 13.19
VII-6A-47a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.87 (1H, m), 1.10-1.63 (15H, m), 1.95 (1H, m), 2.16 (1H, brs), 2.33 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.27 (1H, m), 3.49 (1H, m), 6.23 (1H, brt, J = 5.6 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 3.9 and 5.1 Hz), 7.38 and 7.63 (each 1H, each d, each J = 3.9 Hz), 7.70 (1H, dd, J = 1.5 and 5.1 Hz), 7.75 (1H, dd, J = 1.5 and 3.9 Hz); IR (CHCl ₃) 3514, 3446, 1709, 1657, 1533, 1506, 1402, 1336, 1275, 1153, 1097, 1024 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ -8.1±0.5° (c=1.008, MeOH) 元素分析 (C ₂₃ H ₂₉ NO ₅ S ₃ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.13; H, 5.95; N, 2.80; S, 19.20 実測値 (%): C, 55.15; H, 5.94; N, 3.06; S, 19.14
VII-6A-88a	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 0.86 (1H, m), 1.09-1.61 (15H, m), 1.94 (1H, m), 2.17 (1H, brs), 2.32 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.21 (1H, m), 3.52 (1H, m), 4.15 (2H, s), 5.89 (1H, brt, J = 5.4 Hz), 6.78 (1H, d, J = 3.6 Hz), 6.96 (1H, dd, J = 1.8 and 5.1 Hz), 7.05 (1H, m), 7.28 (1H, dd, J = 3.0 and 5.1 Hz), 7.34 (1H, d, J = 3.6 Hz); IR (CHCl ₃) 3517, 3450, 1709, 1645, 1547, 1514, 1462 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ -9.4±0.5° (c=1.012, MeOH) 元素分析 (C ₂₄ H ₃₁ NO ₃ S ₂) 計算値 (%): C, 64.68; H, 7.01; N, 3.14; S, 14.39 実測値 (%): C, 64.51; H, 6.90; N, 3.17; S, 14.53

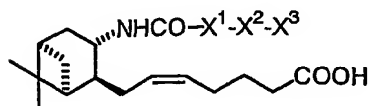
参考例として製造した化合物および物性値を以下の表に示す。なお、参考例において、化合物番号が「I-」で始まる化合物は、式：



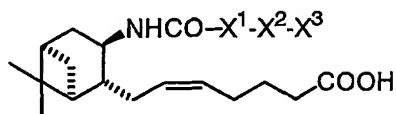
で示される化合物を意味し、化合物番号が「II-」で始まる化合物は、式：



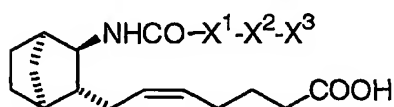
で示される化合物を意味し、化合物番号が「III-」で始まる化合物は、式：



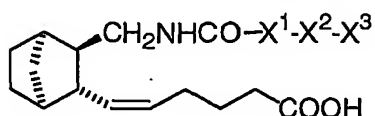
で示される化合物を意味し、化合物番号が「IV-」で始まる化合物は、式：



で示される化合物を意味し、化合物番号が「V-」で始まる化合物は、式：



5 5 で示される化合物を意味し、化合物番号が「VI-」で始まる化合物は、式：



で示される化合物を意味する。また、それらの各記号 (I、II、III、IV、V、および VI) に続く数字は、式： $-X^1-X^2-X^3$ で示される基の構造を表わす。なお、各数字は、上記の式： $-X^1-X^2-X^3$ で示される基のリスト中で使用されてい

10 る数字と同意義である。

化合物番号 I-1

mp.113-114 °C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.09(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.34-1.52(2H, m), 1.56-1.75(4H, m), 2.00-2.18(5H, m), 2.35 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.80(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.22(1H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 6.35 and 7.17(each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 7.37 and 7.56(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3369, 3143, 3124, 3068, 2678, 1710, 1626, 1593, 1374, 1200, 1171 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26.5}+75.5\pm 1.2^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 57.96; H, 5.92; N, 5.88; S, 13.45 実測値 (%) : C, 57.99; H, 5.88; N, 5.66; S, 13.50

化合物番号 I-3

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3\text{-CD}_3\text{OD})$ δ : 1.23(1H, m), 1.28-1.32(2H, m); 1.44-1.53(2H, m), 1.57-1.74(4H, m), 2.03-2.14(5H, m), 2.32(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56(1H, m), 3.82(1H, m), 5.33-5.47(2H, m), 6.80(1H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.22(1H, t, $J=8.1\text{Hz}$), 7.63

and 7.86(each 1H, each d, each $J=8.1\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3593 3442, 3111, 1710, 1644, 1519, 1449 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+77.6 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.76; H, 6.69; N, 3.16; S, 7.23 実測値 (%) : C, 67.64; H, 6.77; N, 3.17; S, 7.18

5 化合物番号 1-4

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-1.80 (4H, m), 2.00-2.22(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.84 (3H, s), 3.85(1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.18(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.93, 7.10, 7.44 and 7.59 (each 2H, each d-like). IR(CHCl_3): 3516, 3448, 1708, 1650, 1594, 1514, 1494, 1483, 1288, 1248, 1032 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+82.8 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.59; H, 6.97; N, 2.90; S, 6.64 実測値 (%) : C, 69.69; H, 6.93; N, 3.20; S, 6.57

化合物番号 1-5

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.16-1.32(2H, m), 1.36-1.50(2H, m), 1.54-1.80 (4H, m), 2.00-2.22(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.82 (1H, m), 3.83(3H, s), 5.29-5.42(2H, m), 6.14(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.92 (2H, d-like), 7.20-7.30(2H, m), 7.41-7.51(4H, m). IR(CHCl_3): 3509, 3444, 2666, 1708, 1654, 1592, 1570, 1510, 1494, 1468, 1288, 1247, 1082 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+58.4 \pm 1.4^\circ$ ($c=0.704$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.59; H, 6.97; N, 2.90; S, 6.64 実測値 (%) : C, 69.55; H, 6.93; N, 3.03; S, 6.57

化合物番号 1-6

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.11(1H, m), 1.20-1.34(2H, m), 1.42-1.52(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 2.00-2.23(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.57(1H, m), 3.89 (1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.30(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.37 and 7.12(each 2H, each 2H, each $J=2.1\text{Hz}$), 7.42 and 7.83(each 2H, each d-like). IR (CHCl_3): 3518, 3448, 2662, 1708, 1653, 1609, 1499, 1334 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+94.9 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_3 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 73.54; H, 7.45; N, 6.86 実測値 (%) :

C, 73.43; H, 7.46; N, 7.01

化合物番号 1-7

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.12-1.76(9H, m), 1.96-2.24(5H, m), 2.33(2H, t, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 2.53(1H, m), 3.86(1H, m), 5.30-5.47(2H, m), 6.60(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.05-7.23(5H, m), 7.55(1H, brs), 7.67 and 7.74(each 2H, each d, each $J=8.7 \text{ Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3439, 3368, 1708, 1653, 1600, 1519, 1496, 1487, 1401, 1347, 1165 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} +69.9 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.019$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.80; H, 6.89; N, 5.60; S, 6.41 実測値 (%): C, 64.73; H, 6.56; N, 5.74; S, 6.41

10 化合物番号 1-8

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.19-1.27(3H, m), 1.35-1.43(2H, m), 1.55-1.80(4H, m), 1.90-2.08(3H, m), 2.11-2.21(2H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.74 (1H, m), 5.29-5.48(2H, m), 6.44(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.15(1H, d, $J=1.5 \text{ Hz}$), 7.46(2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.57(1H, m), 7.60(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.76-7.78 (2H, m), 7.89(1H, s). IR(CHCl_3): 3440, 3360, 3107, 1708, 1637, 1518, 1448, 1329, 1163 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20} +55.5 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.31; H, 6.05; N, 5.53; S, 12.67 実測値 (%): C, 59.19; H, 6.12; N, 5.66; S, 12.50

化合物番号 1-9

20 mp.193-194 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO}) \delta$: 1.18-1.59 (9H, m), 1.93 (1H, d, $J = 2.4 \text{ Hz}$), 1.99-2.07(4H, m), 2.21(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.36(1H, m), 5.30-5.40(2H, m), 7.25(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.54-7.63(3H, m), 7.69(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.99-8.02 (3H, m), 11.6(1H, s), 12.00(1H, brs). IR(Nujol): 3367, 3221, 3186, 3091, 3055, 2654, 1711, 1631, 1566, 1541, 1321 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{21} +74.6 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素
25 分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.93; H, 6.48; N, 6.00; S, 6.87 実測値 (%): C, 66.76; H, 6.44; N, 5.88; S, 6.76

化合物番号 1-10

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.08(1H, m), 1.18-1.34(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.55(1H, m), 3.86 (1H, m), 5.31-5.54(2H, m), 6.26(1H, d, J=7.8Hz), 6.31 and 7.14(each 2H, each t, each J=2.1Hz), 7.84 and 7.88(each 2H, each d, each J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3515, 3441, 3144, 2669, 1708, 1662, 1515, 1486, 1455, 1376 cm⁻¹. [α]_D²²+77.4±1.2° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₀N₂O₆S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 63.32; H, 6.46; N, 6.91; S, 6.76 実測値 (%) : C, 63.23; H, 6.49; N, 5.88; S, 6.67

化合物番号 I-11

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.56-1.79(4H, m), 2.03-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.82(1H, m), 4.12(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 6.04(1H, d, J=7.5Hz), 7.09(1H, d, J=1.5Hz), 7.22-7.34(5H, m), 7.67(1H, d, J=1.5Hz). IR (CHCl₃): 3517, 3446, 2669, 1708, 1647, 1549, 1508, 1454 cm⁻¹. [α]_D^{21.6}+68.8±1.1° (c=1.016, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 71.07; H, 7.16; N, 3.19; S, 7.30 実測値 (%) : C, 71.05; H, 7.11; N, 3.38; S, 7.33

化合物番号 I-12

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.09(1H, m), 1.10-1.30(2H, m), 1.40-1.46(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 2.00-2.22(5H, m), 2.33(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.83(1H, m), 5.28-5.42 (2H, m), 6.26(1H, d, J=6.9Hz), 7.15 and 7.63(each 2H, each d, each J=8.7Hz), 7.53(1H, m), 7.78-7.82(2H, m). IR(CHCl₃): 3515, 3446, 3371, 3138, 1708, 1648, 1610, 1496, 1163 cm⁻¹. [α]_D^{22.5}+66.5±1.1° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₄N₂O₆S · 0.4H₂O) 計算値 (%) : C, 64.11; H, 6.93; N, 5.54; S, 6.34 実測値 (%) : C, 64.05; H, 6.63; N, 5.56; S, 6.12

化合物番号 I-13

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.19-1.31(3H, m), 1.36-1.44(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 1.85-2.02(2H, m), 2.05(1H, m), 2.13-2.47(4H, m), 2.57(1H, m), 3.71(1H, m), 5.31-5.54(2H, m), 6.53(1H, d, J=6.9Hz), 7.14-7.32(5H, m), 7.47(1H, br), 8.05

and 8.13 (each 1H, each d, each $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3509, 3360, 3262, 1709, 1649, 1542, 1496, 1349, 1160 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+59.1\pm 1.1^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.31; H, 6.05; N, 5.53; S, 12.67 実測値 (%) : C, 59.17; H, 6.01; N, 5.49; S, 12.37

5 化合物番号 1-14

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.18-1.32(3H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 1.90-2.08(3H, m), 2.15-2.31(2H, m), 2.32-2.49(2H, m), 2.59(1H, m), 3.74 (1H, m), 5.33-5.53(2H, m), 6.35 and 7.17(each 2H, each t, each $J=2.4\text{Hz}$), 6.47(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 8.21 and 8.22(each 1H, each d, each $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3506, 3412, 3144, 3107, 1727, 1709, 1656, 1540, 1504, 1456, 1382, 1166 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+63.8\pm 1.0^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 57.53; H, 5.96; N, 5.83; S, 13.35 実測値 (%) : C, 57.44; H, 5.96; N, 6.00; S, 13.35

10 化合物番号 1-15

mp.128-130 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.16-1.34(3H, m), 1.40-1.81(6H, m), 2.37 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.57(1H, m), 3.89(1H, m), 5.35-5.51(2H, m), 6.37 and 7.20 (each 2H, each d, each $J=2.4\text{Hz}$), 7.23(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$). IR (Nujol): 3371, 3097, 2662, 1716, 1703, 1671, 1652, 1530, 1367, 1361, 1187, 1162 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+47.5\pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 57.96; H, 5.92; N, 5.88; S, 13.45 実測値 (%) : C, 58.05; H, 5.91; N, 5.83; S, 13.38

20 化合物番号 1-16

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.09(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.58-1.75(4H, m), 2.01(3H, d, $J=1.2\text{Hz}$), 2.00-2.16(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.86(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 6.14(1H, dd, $J=1.5$ and 3.0Hz), 6.29(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.86(1H, m), 7.04(1H, t, $J=3.0\text{Hz}$), 7.84 (4H, s).

25 IR(CHCl_3): 3517, 3441, 2667, 1708, 1661, 1515, 1485, 1375, 1260, 1178 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+73.8\pm 1.1^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 64.20; H, 6.67; N, 5.76; S, 6.59 実測値 (%) : C, 64.14; H, 6.65; N, 5.85;

S, 6.86

化合物番号 1-17

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.20-1.31(3H, m), 1.40-1.47(2H, m), 1.57-1.80(4H, m),
2.00-2.30(5H, m), 2.37(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.60(1H, m), 3.84(1H, m), 5.32-5.50(2H,
5 m), 6.32(2H, t, $J=2.4\text{Hz}$), 6.63(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.16(2H, t, $J=2.4\text{Hz}$), 7.55(1H,
t, $J=8.0\text{Hz}$), 7.89(1H, m), 8.06(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.30(1H, t,
 $J=1.7\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3394, 3145, 1726, 1709, 1659, 1374 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+60.3\pm$
1.0° ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.32;
H, 6.46; N, 5.91; S, 6.76 実測値 (%): C, 63.39; H, 6.50; N, 6.16; S, 6.80

10 化合物番号 1-18

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.10(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.45(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.58-
1.74(4H, m), 2.04-2.16(5H, m), 2.28(3H, s), 2.35(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.55 (1H, m),
3.87(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 5.96(1H, m), 6.18(1H, t, $J=3.3\text{Hz}$), 6.32 (1H, d,
 $J=7.5\text{Hz}$), 7.25(1H, dd, $J=1.8$ and 3.3Hz), 7.78 and 7.85(each 2H, each d, each
15 $J=8.7\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3441, 1708, 1661, 1515, 1487, 1368, 1164 cm^{-1} .
 $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+74.0\pm 1.1^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値
(%): C, 63.96; H, 6.69; N, 5.74; S, 6.57 実測値 (%): C, 63.97; H, 6.69; N, 5.98;
S, 6.54

化合物番号 1-19

20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.07(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.56-
1.76(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.86 (1H, m),
5.09(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 6.19(2H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 6.25(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$),
6.67(2H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 7.13 and 7.70(each 2H, each d, each $J = 8.4\text{Hz}$).
IR(CHCl_3): 3517, 3446, 3103, 2667, 1708, 1653, 1523, 1497 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+57.7$
25 $\pm 1.0^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_3$) 計算値 (%): C, 73.63; H, 7.70;
N, 6.60 実測値 (%): C, 73.72; H, 7.77; N, 6.76

化合物番号 1-20

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.15-1.30(2H, m), 1.36-1.45(2H, m), 1.55-1.72
(4H, m), 2.00-2.14(5H, m), 2.32(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.82 (1H, m),
5.28-5.42(2H, m), 6.22(2H, d, J=7.5Hz), 6.68(1H, d, J=3.6 Hz), 7.22-7.34(2H,
m), 7.52-7.55(2H, m), 7.76 and 7.88(each 2H, each d, each J=8.7Hz), 7.97(1H, d,
5 J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3480, 3440, 3145, 3117, 1708, 1661, 1516, 1485,
1445, 1377, 1130 cm⁻¹. [α]_D²⁵+65.9 ± 1.1 ° (c=1.010, MeOH) 元素分析
(C₂₉H₃₂N₂O₅S · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 66.21; H, 6.25; N, 5.33; S, 6.10 実測値
(%) : C, 66.34; H, 6.30; N, 5.63; S, 5.84

化合物番号 1-21

10 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.13(1H, m), 1.20-1.31(2H, m), 1.44(2H, t, J=6.8Hz), 1.59-
1.72(4H, m), 2.03-2.20(5H, m), 2.32(2H, t, J=7.2Hz), 2.54(1H, m), 3.83 (1H, m),
4.62(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.25-6.26(2H, m), 6.57(1H, d, J=7.2Hz), 7.25(1H,
m), 7.81(4H, s). IR(CHCl₃): 3581, 3518, 3440, 3149, 1708, 1660, 1517, 1486,
1371, 1150 cm⁻¹. [α]_D²⁷+72.2 ± 1.1 ° (c=1.007, MeOH) 元素分析
15 (C₂₆H₃₂N₂O₅S) 計算値 (%) : C, 62.38; H, 6.44; N, 5.60; S, 6.40 実測値 (%) : C,
62.17; H, 6.52; N, 5.71; S, 6.40

化合物番号 1-22

¹H-NMR(d₆-DMSO) δ : 1.18-1.33(3H, m), 1.43-1.60(6H, m), 1.92-2.30(5H, m),
2.20(2H, t, J=7.5Hz), 2.38(1H, m), 3.67(1H, m), 5.30-5.36(2H, m), 6.85 (1H, d,
20 J=4.8Hz), 7.27(1H, d, J=4.8Hz), 7.86 and 7.94(each 2H, each d, each J=8.7Hz),
8.37(1H, d, J=6.9Hz). IR(KBr): 3360, 3151, 3103, 1707, 1635, 1569, 1530,
1328, 1284, 1140 cm⁻¹. [α]_D²⁷+67.4 ± 1.1 ° (c=1.007, DMSO) 元素分析
(C₂₄H₂₉N₃O₅S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 56.62; H, 5.86; N, 8.24; S, 12.60 実測
値 (%) : C, 56.74; H, 5.96; N, 8.30; S, 12.31

25 化合物番号 1-23

mp. 231-232 °C; ¹H-NMR(d₆-DMSO) δ : 1.19-1.61(9H, m), 1.95-2.08(5H, m),
2.21(2H, t, J=7.2Hz), 2.40(1H, m), 3.71(1H, m), 5.34-5.37(2H, m), 7.31 and

7.59(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.98 and 8.16(each 2H, each d, each $J=8.7\text{Hz}$), 8.41(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$). IR(KBr): 3336, 3185, 2541, 1675, 1631, 1548, 1324, 1295, 1163 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{27}+84.5 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.000$, DMSO) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 64.22; H, 6.25; N, 8.99; S, 6.86 実測値 (%) : C, 64.13; H, 6.10; N, 8.92; S, 7.08

化合物番号 1-24

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.14(1H, m), 1.22-1.35(2H, m), 1.44-1.53(2H, m), 1.58-1.78(4H, m), 2.02-2.28(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.58(1H, m), 3.87(1H, m), 5.15-5.48(2H, m), 6.29 and 7.18(each 2H, each t, $J=2.4\text{Hz}$), 6.38(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.77(1H, dd, $J=1.8$ and 8.7Hz), 7.82(1H, s), 7.91(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 8.34(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3441, 3423, 3144, 2670, 1708, 1530, 1501, 1374, 1164 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26}+96.1 \pm 1.4^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 61.16; H, 5.78; N, 5.28; S, 12.09 実測値 (%) : C, 61.17; H, 5.74; N, 5.35; S, 12.12

15 化合物番号 1-25

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.17-1.31(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 1.99-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.84 (1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.20(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.10-7.17(3H, m), 7.32 (1H, dd, $J=1.2$ and 3.6Hz), 7.54(1H, dd, $J=1.2$ and 5.4Hz), 7.60-7.64 (2H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3447, 2669, 1708, 1651, 1596, 1515, 1483 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26}+84.7 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 65.64; H, 6.43; N, 3.06; S, 14.02 実測値 (%) : C, 65.58; H, 6.41; N, 3.10; S, 13.82

化合物番号 1-26

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13(1H, m), 1.20-1.33(2H, m), 1.41-1.50(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.87(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.48(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.10(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1Hz), 7.68(1H, dd, $J=1.2$ and 5.1Hz), 7.69(1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz), 7.84-7.88 and 7.95-

7.99(each 2H, each m). IR(CHCl₃): 3518, 3441, 3382, 1708, 1659, 1515, 1329, 1158 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{26} + 75.7 \pm 1.2^\circ$ (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₅S₂) 計算値 (%) : C, 61.58; H, 5.99; N, 2.87; S, 13.15 実測値 (%) : C, 61.36; H, 6.05; N, 2.91; S, 13.13

5 化合物番号 1-27

mp.213-215 °C; ¹H-NMR(d₆-DMSO) δ : 1.18-1.61(9H, m), 1.95-2.10 (5H, m), 2.21(2H, t, J=7.5Hz), 2.40(1H, m), 3.71(1H, m), 5.33-5.38(2H, m), 7.19(1H, m), 7.87(1H, m), 7.96 and 8.10(each 2H, each d, each J=8.2Hz), 8.21(1H, d, J=8.6Hz), 8.40(1H, m), 10.92(1H, s), 12.05(1H, brs). IR (Nujol): 3337, 3249, 3205, 3132, 2524, 1678, 1632, 1545, 1433, 1305 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{23} + 85.2 \pm 2.5^\circ$ (c=0.505, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₁N₃O₄ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 69.72; H, 6.80; N, 9.03 実測値 (%) : C, 69.76; H, 6.75; N, 8.76

化合物番号 1-28

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.54(1H, m), 3.85 (1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.17(1H, d, J=6.9Hz), 7.07(1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz), 7.15(2H, d J=8.7Hz), 7.43(1H, dd, J=3.0 and 5.1Hz), 7.51(1H, dd, J=1.2 and 3.0Hz), 7.62(2H, d, J=8.7Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3447, 3110, 2666, 1708, 1651, 1596, 1515, 1482 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{27} + 85.9 \pm 1.3^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₃S₂) 計算値 (%) : C, 65.90; H, 6.42; N, 3.07; S, 14.07 実測値 (%) : C, 65.60; H, 6.36; N, 3.36; S, 13.86

化合物番号 1-29

mp.123-125°C; ¹H-NMR (CDCl₃) δ : 1.12(1H, m), 1.18-1.34(2H, m), 1.42-1.50(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 2.02-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.55(1H, m), 3.88(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.42(1H, d, J=6.0Hz), 7.31 (1H, d, J=5.1Hz), 7.40(1H, dd, J=3.0 and 5.1Hz), 7.87 and 7.96(each 2H, each d, each J=8.7Hz), 8.11(1H, d, J=3.0Hz). IR(Nujol): 3286, 3108, 2671, 1701, 1641, 1546, 1327,

1156 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27} + 75.3 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 61.58; H, 5.99; N, 2.87; S, 13.15 実測値 (%) : C, 61.39; H, 5.94; N, 3.02; S, 12.99

化合物番号 1-30

- 5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.12(1H, m), 1.23-1.34(2H, m), 1.43-1.52(2H, m), 1.58-1.79(4H, m), 2.02-2.24(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.87 (1H, m), 5.32-5.45(2H, m), 6.11(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.28(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.35 and 7.09(each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 7.16(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3512, 3438, 3142, 1741, 1709, 1653, 1623, 1564, 1508 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 102.4 \pm 1.4^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_4 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.05; H, 7.15; N, 7.00 実測値 (%) : C, 69.12; H, 7.10; N, 6.95
- 10

化合物番号 1-31

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.04(1H, m), 1.08-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 1.99-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.81(1H, m), 4.13(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.96(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.77(1H, ddd, $J=0.9, 0.9$ and 3.9Hz), 7.20-7.35(5H, m), 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3511, 3445, 2670, 1708, 1642, 1544, 1507, 1455 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 67.1 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.015$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 71.36; H, 7.14; N, 3.20; S, 7.33 実測値 (%) : C, 71.19; H, 7.16; N, 3.34; S, 7.26
- 15

- 20 化合物番号 1-32

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.22-1.85(9H, m), 1.95-2.53(7H, m), 2.66(1H, m), 3.84(1H, m), 5.37-5.60(2H, m), 6.79(1H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 7.01-7.17(5H, m), 7.83 (1H, dd, $J=1.5$ and 8.7Hz), 7.53(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.89(1H, s), 8.35 (1H, s), 8.83(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3509, 3437, 3364, 3209, 1710, 1634, 1495, 1344, 1158 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 36.6 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 62.61; H, 5.87; N, 5.04; S, 11.53 実測値 (%) : C, 62.53; H, 5.87; N, 5.21; S, 11.42
- 25

化合物番号 1-33

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13(1H, m), 1.20-1.37(2H, m), 1.46-1.56(2H, m), 1.60-1.80
 (4H, m), 2.02-2.28(5H, m), 2.38(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.64(1H, m), 3.94 (1H, m),
 5.35-5.50(2H, m), 6.21(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.28 and 7.21(each 2H, each t, each
 5 $J=2.4\text{Hz}$), 7.81(1H, dd, $J=1.8$ and 8.7Hz), 7.91(1H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.99(1H, s),
 8.97(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3513, 3438, 3144, 3096, 1708, 1656, 1518,
 1374 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} +40.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot$
 0.2 H_2O) 計算値 (%) : C, 61.16; H, 5.78; N, 5.28; S, 12.09 実測値 (%) : C, 61.16;
 H, 5.76; N, 5.43; S, 12.05

10 化合物番号 1-34

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.18-1.35(3H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.57-1.79(4H, m),
 1.99-2.21(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.50(1H, m), 3.80(1H, m), 5.32-5.47(2H,
 m), 6.38(2H, t, $J=2.4\text{Hz}$), 6.54(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.12 and 7.13(each 1H, each d,
 each $J=3.6\text{Hz}$), 7.20(2H, t, $J=2.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3433, 3144, 2686, 1708,
 15 1669, 1591, 1528, 1475, 1457, 1394 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} +74.3 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.007$, MeOH)
 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 59.98; H, 6.13; N, 6.08; S, 6.96 実測
 値 (%) : C, 59.71; H, 6.22; N, 6.10; S, 7.02

化合物番号 1-35

mp.102-103°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.38-
 20 1.48(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 1.99-2.19(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H,
 m), 3.81(1H, m), 5.20(2H, d, $J=0.9\text{Hz}$), 5.30-5.42(2H, m), 5.99 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$),
 6.20 and 6.71 (each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 6.86(1H, td, $J=0.9$ and 3.9Hz),
 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3393, 3093, 6064, 2669, 1704, 1616, 1523,
 1522 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} +71.1 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$) 計算
 25 値 (%) : C, 67.58; H, 7.09; N, 6.57; S, 7.52 実測値 (%) : C, 67.45; H, 7.09; N,
 6.58; S, 7.67

化合物番号 1-36

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.82 (1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.02(1H, d, J=7.2Hz), 7.15 and 7.44 (each 1H, each d, each J=3.9Hz), 7.20-7.33(5H, m). IR(CHCl₃): 3511, 3444, 3426, 3031, 2665, 1708, 1646, 1530, 1499, 1477, 1421, 1318 cm⁻¹. [α]_D²⁶+74.8±1.1° (c=1.004, MeOH)
 5 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₃S₂) 計算値 (%) : C, 65.90; H, 6.42; N, 3.07; S, 14.07 実測値 (%) : C, 65.61; H, 6.40; N, 3.19; S, 14.18

化合物番号 1-37

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.09(1H, m), 1.17-1.31(2H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.54-1.74(4H, m), 2.00-2.17(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.80 (1H, m), 5.30-5.43(2H, m), 6.27(1H, d, J=7.2Hz), 7.41(1H, d, J = 4.2 Hz), 7.51-7.64(4H, m), 7.98(2H, m). IR(CHCl₃): 3515, 3442, 3366, 1708, 1656, 1530, 1504, 1327, 1156 cm⁻¹. [α]_D²⁶+73.1±1.1° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₅S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 61.13; H, 6.03; N, 2.85; S, 13.05 実測値 (%) : C, 60.94;
 10 H, 6.02; N, 2.86; S, 13.12

化合物番号 1-38

mp.163-165 °C ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.24-1.43(3H, m), 1.52-1.87 (8H, m), 2.10(1H, d, J=3.0Hz), 2.30-2.55(4H, m), 2.71(1H, m), 3.66(1H, m), 5.38 and 5.63(each 1H, each m), 7.13(1H, d, J=1.5Hz), 7.34(1H, d, J=5.4 Hz), 7.49-7.60(3H, m), 7.86-7.89(2H, m), 8.49(1H, s), 8.69(1H, d, J=1.5Hz). IR(KBr): 3367, 3261, 3090, 1726, 1645, 1618, 1589, 1577, 1535, 1513, 1426, 1396, 1289, 1197 cm⁻¹. [α]_D²³+84.5±1.2° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₀N₂O₄S) 計算値 (%) : C, 66.93; H, 6.48; N, 6.00; S, 6.87 実測値 (%) : C, 66.97; H, 6.36; N, 6.01; S, 6.89

25 化合物番号 1-39

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.25-1.80(9H, m), 1.87-2.05(3H, m), 2.14-2.29(2H, m), 2.37(2H, t, J=6.9Hz), 2.57(1H, m), 3.73(1H, m), 5.35 and 5.49(each 1H, each m),

6.71(1H, d, J=6.6Hz), 6.87(1H, d, J=1.5Hz), 7.43-7.48(2H, m), 7.56 (1H, m),
 7.63(1H s), 7.64((1H, d, J=1.5Hz), 7.73-7.76(2H, m). IR (CHCl₃): 3510, 3379,
 3247, 3108, 1709, 1637, 1556, 1516, 1448, 1365, 1319, 1161 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{23} +61.1$
 5 $\pm 1.0^\circ$ (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₀N₂O₆S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C,
 59.31; H, 6.05; N, 5.53; S, 12.67 実測値 (%) : C, 59.38; H, 6.11; N, 5.75; S, 12.41
 化合物番号 1-40

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.11(1H, m), 1.24-1.31(2H, m), 1.44-1.52(2H, m), 1.60-1.79
 (4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2Hz), 2.56(1H, m), 3.86 (1H, m),
 5.32-5.46(2H, m), 6.11(1H, d, J=7.8Hz), 7.25 and 7.49(each 1H, each d, each
 10 J=4.2Hz), 7.30-7.43(3H, m), 7.60-7.63(2H, m). IR(CHCl₃): 3510, 3445, 3428,
 1739, 1708, 1643, 1540, 1510, 1491, 1454 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{35} +88.0 \pm 1.3^\circ$ (c=1.012,
 MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₅S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 70.29; H, 6.94; N, 3.28;
 S, 7.51 実測値 (%) : C, 70.35; H, 7.01; N, 3.59; S, 7.46

化合物番号 1-41

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.13(1H, m), 1.22-1.32(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.60-
 1.76(4H, m), 2.04-2.17(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.57(1H, m), 3.86(1H, m),
 5.32-5.46(2H, m), 6.30(1H, d, J=8.4Hz), 7.48-7.65(5H, m), 7.84-7.88(2H, m).
 IR(CHCl₃): 3511, 3443, 3425, 1708, 1643, 1529, 1506, 1448 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +92.4$
 $\pm 1.3^\circ$ (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₂₉NO₄S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C,
 20 68.61; H, 6.51; N, 3.08; S, 7.04 実測値 (%) : C, 68.55; H, 6.52; N, 3.13; S, 7.03

化合物番号 1-42

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.27-1.31(2H, m), 1.49(2H, brs), 1.59-1.80 (4H,
 m), 2.00-2.20(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.55(1H, m), 3.85 (1H, m), 5.31-
 5.45(2H, m), 6.14(1H, d, J=7.2Hz), 7.13(1H, d, J=3.9Hz), 7.30 (1H, dd, J=1.2
 25 and 5.1Hz), 7.36(1H, dd, J=3.0 and 5.1Hz), 7.45-7.46 (2H, m). IR(CHCl₃): 3511,
 3445, 3428, 3109, 1708, 1642, 1523, 1499, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +82.9 \pm 1.2^\circ$
 (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₇NO₃S₂ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 64.04; H,

6.36; N, 3.25; S, 14.86 実測値 (%) : C, 63.99; H, 6.52; N, 3.23; S, 14.85

化合物番号 1-43

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.22-1.31(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.60-1.80(4H, m), 2.03-2.22(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2Hz), 2.55(1H, m), 3.85 (1H, m),
 5 5.32-5.45(2H, m), 6.07(1H, d, J=7.5Hz), 7.04(1H, dd, J=3.6 and 5.4Hz), 7.11(1H, d, J=3.9Hz), 7.24(1H, dd, J=1.2 and 3.6Hz), 7.28(1H, dd, J=1.2 and 5.4Hz), 7.42(1H, d J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3511, 3445, 3428, 3113, 3073, 2667, 1708, 1643, 1521, 1498, 1455 cm⁻¹. [α]_D²⁵+89.5±1.3° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₇NO₃S₂ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 64.04; H, 6.36; N, 3.25; S, 14.86 実測
 10 値 (%) : C, 63.93; H, 6.39; N, 3.46; S, 14.61

化合物番号 1-44

mp.146-147°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.24-1.31(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.61-1.82(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2Hz), 2.37(3H, s), 2.56(1H, m), 3.85(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.06(1H, d, J=6.9 Hz), 7.20 and
 15 7.51(each 2H, each d, each J=9.0Hz), 7.21 and 7.48(each 1H, each d, each J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3445, 3428, 1740, 1708, 1642, 1542, 1518, 1498, 1451 cm⁻¹. [α]_D²⁶+89.3±1.3° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₃S) 計算値 (%) : C, 71.36; H, 7.14; N, 3.20; S, 7.33 実測値 (%) : C, 71.51; H, 7.10; N, 3.20; S, 7.33

20 化合物番号 1-45

mp.110-116°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.24-1.31(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.61-1.83(4H, m), 2.00-2.25(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2 Hz), 2.56(1H, m), 3.84(3H, s), 3.85(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.04(1H, d, J=7.5Hz), 6.93 and
 25 7.55(each 2H, each d, each J=8.7Hz), 7.15 and 7.46 (each 2H, each d, each J=4.2Hz). IR(CHCl₃): 3515, 3445, 3428, 1740, 1708, 1640, 1608, 1541, 1499, 1453, 1178 cm⁻¹. [α]_D²⁶+88.0 ± 1.3 ° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₄S) 計算値 (%) : C, 68.85; H, 6.89; N, 3.09; S, 7.07 実測値 (%) : C,

68.87; H, 6.82; N, 3.11; S, 7.19

化合物番号 1-46

mp.124-125°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10(1H, m), 1.24-1.32(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.61-1.82(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (1H, m),
5 3.85(1H, m), 5.32-5.45(2H, m), 6.06(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.10 (2H, t, $J=8.7\text{Hz}$),
6.19 and 7.47(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.56-5.60 (2H, m). IR(CHCl_3):
3516, 3445, 3428, 2672, 1740, 1708, 1643, 1542, 1519, 1498, 1452 cm^{-1} .
[α] $_D^{26}+83.3\pm 1.2^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{28}\text{FNO}_3\text{S}$) 計算値 (%): C,
68.00; H, 6.39; N, 3.17; F, 4.30; S, 7.26 実測値 (%): C, 67.90; H, 6.34; N, 3.25;
10 F, 4.31; S, 7.20

化合物番号 1-47

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.56-
1.76(4H, m), 2.00-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.81 (1H, m),
5.31-5.43(2H, m), 6.32(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.11(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1Hz), 7.42
15 and 7.62(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 7.70(1H, dd, $J=1.5$ and 5.1Hz),
7.74(1H, dd, $J=1.5$ and 3.9Hz). IR(CHCl_3): 3516, 3442, 3378, 1708, 1655, 1530,
1504, 1336, 1153 cm^{-1} . [α] $_D^{25}+74.3\pm 1.1^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析
($\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.76; H, 5.53; N, 2.83; S, 19.41 実測
値 (%): C, 55.49; H, 5.64; N, 3.09; S, 19.32

20 化合物番号 1-48

mp.112-115°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13-1.30(3H, m), 1.34-1.45 (2H, m), 1.50-
1.82(4H, m), 1.94-2.27(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (1H, m), 3.74(1H, m),
5.22(2H, s), 5.31-5.50(2H, m), 6.64(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 6.84 (1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.93
and 7.05(each 1H, each s), 7.47(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.66(1H, s). IR(Nujol): 3339,
25 3102, 2464, 1691, 1635, 1622, 1551, 1288 cm^{-1} . [α] $_D^{25}+71.2\pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$,
MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_3\text{S}$) 計算値 (%): C, 64.61; H, 6.84; N, 9.83; S, 7.50
実測値 (%): C, 64.54; H, 6.85; N, 9.78; S, 7.42

化合物番号 1-49

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.08(1H, m), 1.16-1.30(2H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.54-1.77(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.79 (1H, m), 5.30-5.42(2H, m), 5.47(2H, s), 6.16(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.30(1H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 6.94 and 7.41(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.47 and 7.57 (each 1H, each d, each $J=2.1\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3444, 3426, 1709, 1646, 1546, 1512 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+68.6\pm 1.1^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_3\text{O}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.34; H, 6.85; N, 9.79; S, 7.47 実測値 (%): C, 64.10; H, 6.93; N, 9.90; S, 7.52

10 化合物番号 1-50

mp.126-128°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.12(1H, m), 1.18-1.33(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.54(1H, m), 3.87(1H, m), 5.30-5.44(2H, m), 6.43(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.48-7.62(3H, m), 7.83-7.95(5H, m). IR(Nujol): 3284, 3058, 2669, 1701, 1641, 1546, 1326, 1294, 1160 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+77.2\pm 1.2^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 67.34; H, 6.49; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%): C, 67.20; H, 6.38; N, 2.88; S, 6.58

化合物番号 1-51

mp.103-107°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.14(1H, m), 1.18-1.33(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.54-1.77(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.54(1H, m), 3.85(3H, s), 3.86(1H, m), 5.30-5.45(2H, m), 6.48(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.96(2H, m), 7.81-7.91(6H, m). IR(Nujol): 3273, 3067, 2669, 1702, 1639, 1560, 1548, 1323, 1301, 1274, 1156 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+75.4\pm 1.2^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_6\text{S}$) 計算値 (%): C, 65.73; H, 6.50; N, 2.74; S, 6.27 実測値 (%): C, 65.50; H, 6.46; N, 2.82; S, 6.25

25 化合物番号 1-52

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.17(1H, m), 1.26-1.34(2H, m), 1.47-1.53(2H, m), 1.60-1.76(4H, m), 2.04-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60(1H, m), 3.91(1H, m),

5.32-5.47(2H, m), 6.46(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.17(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1Hz), 7.61(1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz), 7.76(1H, dd, $J=1.2$ and 5.1Hz), 7.87(4H, s-like).

IR(CHCl_3): 3518, 3444, 2663, 1708, 1638, 1517, 1494, 1414 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+86.6 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 69.15; H,

5 6.47; N, 3.10; S, 7.10 実測値 (%) : C, 68.86; H, 6.70; N, 3.15; S, 6.95

化合物番号 I-53

mp.144-145°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.20-2.54(16H, m), 2.62(1H, m), 3.69 (3H, s), 5.35-5.56(2H, m), 6.36 and 7.17(each 2H, each t, each $J=2.4\text{Hz}$), 6.66(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 8.05 and 8.07(each 1H, each d, each $J=1.5\text{Hz}$). IR(Nujol): 3509,

10 3406, 3146, 3110, 1728, 1708, 1653, 1535, 1375, 1189, 1166 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+67.9 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 57.96; H, 5.92; N, 5.88; S, 13.45 実測値 (%) : C, 58.19; H, 5.95; N, 5.75; S, 13.09

化合物番号 I-54

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.22-2.57(16H, m), 2.68(1H, m), 3.66(3H, s), 5.37-5.63 (2H,

15 m), 6.20, 6.35, 6.74 and 6.87(each 2H, each t, each $J=2.4\text{Hz}$), 6.92 (1H, d, $J=5.4\text{Hz}$), 8.27(1H, s). IR(CHCl_3): 3402, 3143, 3108, 1725, 1710, 1650, 1516, 1375 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+70.0 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.28; H, 5.82; N, 7.68; S, 11.72 実測値 (%) : C, 59.28; H, 5.77; N, 5.58; S, 11.68

20 化合物番号 I-55

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.45(2H, m), 1.57-1.74(4H, m), 2.00-2.10(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.38(3H, s), 2.52 (1H, m), 3.80(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 5.99(1H, m), 6.20(1H, t, $J=3.3\text{Hz}$), 6.30(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.18(1H, dd, $J=1.8$ and 3.3Hz), 7.40 and 7.53(each 1H, each d, each

25 $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3513, 3442, 3149, 3100, 1708, 1657, 1530, 1504, 1375, 1183, 1161 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+70.3 \pm 1.5^\circ$ ($c=0.730$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 57.90; H, 6.24; N, 5.63; S, 12.88 実測

値 (%) : C, 58.08; H, 6.28; N, 5.77; S, 12.54

化合物番号 1-56

¹H-NMR(d₆-DMSO) δ : 1.06-1.59(9H, m), 1.93-2.07(5H, m), 2.21(2H, t, J = 7.2 Hz), 2.35(1H, m), 3.65(1H, m), 5.30-5.41(2H, m), 6.90 and 7.69 (each 1H, each d, each J=4.2Hz), 7.55-7.64(3H, m), 7.99-8.04(3H, m), 11.73 (1H, s), 12.01(1H, brs). IR (KBr): 3562, 1708, 1616, 1564, 1523, 1454, 1295 cm⁻¹. [α]_D²⁷+71.2±1.1° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₀N₂O₄S·0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 66.42; H, 6.52; N, 5.96; S, 6.82 実測値 (%) : C, 66.43; H, 6.32; N, 6.17; S, 6.75

化合物番号 1-57

¹H-NMR(d₆-DMSO) δ : 1.05-1.56(9H, m), 1.91-2.05(5H, m), 2.19(2H, t, J=7.2Hz), 2.29(1H, m), 3.56(1H, m), 5.28-5.38(2H, m), 6.54 and 7.56(each 1H, each d, each J=4.2Hz), 7.59-7.62(3H, m), 7.76-7.79(2H, m), 8.06(1H, d, J=6.9Hz), 11.10(1H, s), 11.99(1H, brs). IR(KBr): 3384, 3084, 1707, 1616, 1553, 1523, 1459, 1350, 1322, 1161 cm⁻¹. [α]_D²⁷+62.4±1.0° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₀N₂O₅S₂·0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 59.31; H, 6.05; N, 5.53; S, 12.66 実測値 (%) : C, 59.36; H, 5.75; N, 5.55; S, 12.38

化合物番号 1-58

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.17-1.33(2H, m), 1.36-1.50(2H, m), 1.54-1.75(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.45(3H, s), 2.52 (1H, m), 3.80(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.12(1H, d, J=7.5Hz), 6.32 and 7.18(each 2H, each t, each J=2.4Hz), 7.22(1H, s). IR(CHCl₃): 3316, 3442, 3145, 2668, 1708, 1657, 1545, 1509, 1455, 1375, 1190, 1165, 1057 cm⁻¹. [α]_D²⁶+75.8±1.2° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₃₀N₂O₅S₂·0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 58.54; H, 6.18; N, 5.69; S, 13.02 実測値 (%) : C, 58.35; H, 6.29; N, 5.74; S, 12.92

化合物番号 1-59

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.16-1.30(2H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.53-1.79(4H, m), 1.98-2.17(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.50(1H, m), 3.79(1H, m),

5.30-5.42(2H, m), 6.00(1H, d, J=7.5Hz), 7.01(1H, dd, J=3.6 and 5.4Hz), 7.03(1H, d, J=3.9Hz), 7.29(1H, dd, J=1.2 and 3.6Hz), 7.33(1H, d, J=3.9) 7.43(1H, dd, J=1.2 and 5.4Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3444, 3426, 2670, 1708, 1645, 1530, 1499, 1421, 1318 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{26} + 70.8 \pm 1.1^\circ$ (c=1.018, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₇NO₃S₃) 計算値 (%): C, 59.84; H, 5.89; N, 3.03; S, 20.84 実測値 (%): C, 59.73; H, 5.99; N, 3.15; S, 20.70

化合物番号 I-60

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.07(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-1.80(4H, m), 1.99-2.21(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.54(1H, m), 3.85 (1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.20(1H, d, J=6.9Hz), 7.23-7.45(7H, m), 7.55 (2H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3447, 2667, 1708, 1651, 1596, 1514, 1481 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{28} + 89.1 \pm 1.3^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₁NO₃S · 0.2H₂O) 計算値 (%): C, 71.56; H, 6.98; N, 3.09; S, 7.07 実測値 (%): C, 71.39; H, 6.97; N, 3.16; S, 6.94

15 化合物番号 I-61

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.06(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.41-1.50(2H, m), 1.55-1.80(4H, m), 1.99-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.82(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 5.97(1H, d, J=6.6Hz), 6.45(1H, d, J=4.2Hz), 7.11-7.20(3H, m), 7.28(1H, d, J=4.2Hz), 7.33-7.40(2H, m). IR(CHCl₃): 3515, 3445, 3427, 2667, 1740, 1708, 1640, 1506, 1475 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{27} + 71.3 \pm 1.1^\circ$ (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₄S) 計算値 (%): C, 68.31; H, 6.65; N, 3.19; S, 7.29 実測値 (%): C, 68.41; H, 6.87; N, 3.22; S, 7.35

化合物番号 I-62

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.14(1H, m), 1.20-1.35(2H, m), 1.42-1.54(2H, m), 1.57-1.77(4H, m), 2.00-2.23(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.58(1H, m), 3.88(1H, m), 5.32-5.46(2H, m), 6.31 and 7.19(each 2H, each t, each J=2.4 Hz), 6.33(1H, d, J=7.5Hz), 7.77(1H, dd, J=1.8 and 8.4Hz), 7.77(1H, s), 7.87(1H, d, J=8.4Hz),

8.38(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3442, 3422, 3144, 2670, 1708, 1654, 1525, 1375, 1193, 1171 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+89.8\pm1.3^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 61.58; H, 5.74; N, 5.32; S, 12.17 実測値 (%) : C, 61.42; H, 5.86; N, 5.57; S, 11.98

5 化合物番号 1-63

mp.180-181°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.04(1H, m), 1.22-1.30(2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.59-1.82(4H, m), 1.94-2.16(3H, m), 2.25-2.37(2H, m), 2.42 (2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 2.52(3H, s), 3.79(1H, m), 5.41-5.59(2H, m), 5.73(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.48-7.53(2H, m), 7.60(1H, m), 8.07-8.10(2H, m). IR(Nujol): 3372, 3173, 3053, 2544, 1690, 1672, 1632, 1559, 1496, 1362, 1317 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{28}+77.7\pm1.2^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 64.84; H, 6.49; N, 8.72; S, 6.66 実測値 (%) : C, 64.66; H, 6.31; N, 8.73; S, 6.65

化合物番号 1-64

$^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO})$ δ : 1.07(1H, m), 1.28-1.58(8H, m), 1.91-2.08(5H, m), 2.20(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.31(3H, s), 2.32(1H, s), 3.96(1H, m), 5.28-5.40(2H, m), 7.52-7.62(3H, m), 7.80-7.83(2H, m), 7.94(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3316, 3161, 3106, 2677, 1709, 1629, 1531, 1284, 1142 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+76.2\pm1.2^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 57.80; H, 6.05; N, 8.09; S, 12.34 実測値 (%) : C, 57.59; H, 6.15; N, 8.10; S, 12.57

20 化合物番号 1-65

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.28-1.31(2H, m), 1.47(2H, brs), 1.56-1.84(4H, m), 1.94-2.30(5H, m), 2.39(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.62(1H, s), 2.63(3H, s), 3.77(1H, m), 5.35-5.67(2H, m), 6.42(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.29-7.43(3H, m), 7.46(1H, s), 7.72(2H, d, $J=7.2\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3517, 3421, 3350, 3150, 2538, 1708, 1651, 1590, 1512, 1474, 1442, 1164 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{28}+100.8\pm1.4^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{31}\text{N}_3\text{O}_3\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.64; H, 6.63; N, 8.63; S, 6.59 実測値 (%) : C, 66.55; H, 6.59; N, 8.68; S, 6.76

化合物番号 1-66

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.19-1.33(2H, m), 1.42-1.50(2H, m), 1.58-1.79(4H, m), 2.01-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.86(1H, m), 4.37(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.19(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.90(1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz), 6.93(1H, m), 7.17(1H, dd, $J=1.2$ and 5.1Hz), 7.33 and 7.65(each 2H, each d, $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3447, 2665, 1708, 1651, 1596, 1515, 1484 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+82.4\pm 1.4^\circ$ ($c=0.900$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.24; H, 6.67; N, 2.97; S, 13.60 実測値 (%) : C, 66.14; H, 6.72; N, 2.96; S, 13.53

10 化合物番号 1-67

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.16(1H, m), 1.21-1.34(2H, m), 1.43-1.52(2H, m), 1.57-1.76(4H, m), 2.04-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56(1H, m), 3.89 (1H, m), 4.53(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 6.58(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.83(1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz), 6.93(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1Hz), 7.28(1H, dd, $J=1.2$ and 5.1Hz), 7.65 and 7.81(each 2H, each d, $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3442, 3373, 2666, 1708, 1658, 1516, 1483, 1323, 1153 m^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+69.6\pm 1.1^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 61.15; H, 6.32; N, 2.74; S, 12.56 実測値 (%) : C, 66.16; H, 6.25; N, 2.90; S, 12.57

化合物番号 1-68

20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.38-1.50(2H, m), 1.54-1.77(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.80 (1H, m), 5.31-5.46(2H, m), 6.47(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.87(1H, dd, $J=1.5$ and 3.6Hz), 6.84(1H, dd, $J=3.6$ and 5.4Hz), 7.03(1H, dd, $J=1.5$ and 5.4Hz), 7.33 and 7.38(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 7.90(1H, br). IR(CHCl_3): 3510, 3440, 3358, 3109, 1708, 1647, 1533, 1505, 1364, 1331, 1161 cm^{-1} . $[\alpha]_{436}^{29}+151.3\pm 1.9^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_8 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 54.12; H, 5.57; N, 5.49; S, 18.84 実測値 (%) : C, 53.84; H, 5.46; N, 5.38; S, 18.62

化合物番号 1-69

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.20(1H, m), 1.26-1.38(2H, m), 1.42-1.52(2H, m), 1.57-1.76(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.88 (1H, m), 5.31-5.49(2H, m), 6.63(1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz), 6.69(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.77(1H, dd, $J=3.9$ and 5.4Hz), 6.98(1H, dd, $J=1.2$ and 5.4Hz), 7.66 and 7.76(each 2H, each d, each $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3509, 3439, 3363, 3111, 1707, 1651, 1520, 1328, 1167 cm^{-1} . $[\alpha]_{436}^{29}+155.7 \pm 2.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.10; H, 6.07; N, 5.51; S, 12.62 実測値 (%) : C, 59.00; H, 5.95; N, 5.51; S, 12.46

10 化合物番号 1-70

mp.187-188°C; $^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO}) \delta$: 1.16-1.62(9H, m), 1.90-2.14(5H, m), 2.21(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.38(1H, m), 3.66(1H, m), 5.27-5.41(2H, m), 7.10-7.15 (1H, m), 7.34-7.39(2H, m), 7.42-7.75(2H, m), 7.91 and 7.99(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 10.32(1H, s), 12.02(1H, s). IR(Nujol): 3316, 3075, 2678, 1704, 1635, 1614, 1544, 1323 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{28}+83.3 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 66.93; H, 6.48; N, 6.00; S, 6.87 実測値 (%) : C, 67.04; H, 6.45; N, 5.98; S, 6.96

化合物番号 1-71

mp.192-194°C; $^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO}) \delta$: 1.16-1.62(9H, m), 1.90-2.14(5H, m), 2.21(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.37(1H, m), 3.65(1H, m), 5.29-5.41(2H, m), 7.18-7.24 (2H, m), 7.33-7.78(2H, m), 7.91 and 7.97(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 10.38(1H, s), 12.01(1H, s). IR(Nujol): 3322, 3278, 3150, 3098, 3077, 2678, 1704, 1635, 1615, 1546, 1521, 1508, 1322 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{28}+83.3 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{29}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 64.44; H, 6.03; N, 5.78; F, 3.92; S, 6.62 実測値 (%) : C, 64.36; H, 6.00; N, 5.81; F, 3.94; S, 6.46

化合物番号 1-72

mp.192-193°C; $^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO}) \delta$: 1.16-1.62(9H, m), 1.92-2.14 (5H, m),

2.21(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.37(1H, m), 3.66(1H, m), 3.75(3H, s), 5.30-5.41(2H, m),
 6.94 and 7.63(each 2H, each d-like), 7.89 and 7.94(each 1H, each d, each
 $J=3.9\text{Hz}$), 8.38(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 10.21(1H, s), 12.01(1H, s). IR(Nujol): 3316,
 3075, 2678, 1704, 1635, 1614, 1544, 1323 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+81.6\pm 1.2^\circ$ ($c=1.000$,
 5 MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 65.30; H, 6.49; N, 5.64; S,
 6.46 実測値 (%) : C, 65.19; H, 6.49; N, 5.45; S, 6.31

化合物番号 I-73

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.14(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.40-1.78(6H, m), 1.94-2.20
 (5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m), 3.81(6H, s), 3.82(3H,
 10 s), 5.30-5.44(2H, m), 6.56(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.97(2H, s), 7.47 and 7.58(each 1H,
 each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 8.43(1H, s). IR(CHCl_3): 3515, 3438, 3317, 1708, 1650,
 1607, 1537, 1508, 1454, 1412, 1131 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+75.8\pm 1.2^\circ$ ($c=1.009$, MeOH)
 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_7\text{S}\cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 61.77; H, 6.58; N, 4.97; S, 5.69
 実測値 (%) : C, 61.74; H, 6.64; N, 4.89; S, 5.89

15 化合物番号 I-74

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.10(1H, m), 1.20-1.33(2H, m), 1.43-1.52(2H, m), 1.57-
 1.78(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.85(1H, m),
 5.32-5.45(2H, m), 6.09(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.32 and 7.00(each 2H, each t, each
 $J=2.1\text{Hz}$), 6.81 and 7.34(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3515, 3445,
 20 3109, 2678, 1740, 1708, 1642, 1507, 1489 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+83.5\pm 1.2^\circ$ ($c=1.007$,
 MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 66.96; H, 6.84; N, 6.79; S, 7.77
 実測値 (%) : C, 66.66; H, 6.74; N, 6.74; S, 7.61

化合物番号 I-75

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.09(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.39-1.49(2H, m), 1.57-
 25 1.66(4H, m), 2.01-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56(1H, m), 3.88(1H, m),
 3.95(2H, s), 5.30-5.44(2H, m), 6.27(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.89-6.91(2H, m), 7.32(1H,
 dd, $J=2.4$ and 3.9Hz), 7.19 and 7.66(each 2H, each d, $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3):

3516, 3447, 2670, 1708, 1651, 1523, 1496 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26} + 71.8 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.24; H, 6.67; N, 2.97; S, 13.60 実測値 (%) : C, 66.36; H, 6.67; N, 3.27; S, 13.62

化合物番号 1-76

5 mp.135-136°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.12(1H, m), 1.22-1.33(2H, m), 1.43-1.51(2H, m), 1.59-1.78(4H, m), 2.03-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (1H, m), 3.87(1H, m), 4.44(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.30(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.08(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1Hz), 7.23(2H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.40(1H, dd, $J=1.5$ and 3.9Hz), 7.69-7.71(3H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3445, 3096, 2665, 1708, 1655, 1523, 1496,
10 1403, 1327, 1152, 1127 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26} + 65.0 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 61.81; H, 6.26; N, 2.77; S, 12.69 実測値 (%) : C, 61.76; H, 6.20; N, 2.90; S, 12.57

化合物番号 1-77

mp.215-217°C $^1\text{H-NMR}(\text{d}_6\text{-DMSO}) \delta$: 1.16-1.62(9H, m), 1.90-2.14 (5H, m),
15 2.21(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.38(1H, m), 3.66(1H, m), 5.29-5.41 (2H, m), 6.91-6.94(2H, m), 7.05(1H, dd, $J=2.4$ and 4.2Hz), 7.93 and 7.96 (each 1H, each d, each $J=4.2\text{Hz}$), 8.43(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 10.67(1H, br), 12.01 (1H, br). IR(Nujol): 3315, 3222, 3097, 3049, 2672, 1705, 1621, 1548, 1504, 1311 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{27} + 88.2 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 60.99; H, 5.97; N, 5.93; S, 13.57 実測値 (%) : C, 60.94; H, 5.74; N, 5.91; S, 13.61
20

化合物番号 1-78

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.47(2H, m), 1.57-1.73(4H, m), 2.00-2.12(5H, m), 2.31(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56(1H, m), 3.79 (1H, m), 4.70(2H, s), 5.30-5.45(2H, m), 6.26-6.30(2H, m), 6.34(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.22(1H, dd, $J=1.8$ and 3.3Hz), 7.41 and 7.62(each 1H, each d, each $J=4.2\text{Hz}$).
25 IR(CHCl_3): 3589, 3516, 3441, 3355, 3100, 1708, 1656, 1530, 1504, 1377, 1180, 1147 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26.5} + 70.8 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}_2 \cdot$

0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 56.50; H, 6.01; N, 5.49; S, 12.57 実測値 (%) : C, 56.43;
H, 6.02; N, 5.61; S, 12.47

化合物番号 1-79

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.16-1.30(2H, m), 1.38-1.50(2H, m), 1.54-
5 1.77(4H, m), 1.98-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m),
5.30-5.42(2H, m), 6.03(1H, d, J=7.2Hz), 7.04-7.06(2H, m), 7.32-7.35(2H, m),
7.37(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3509, 3444, 3426, 3110, 2667, 1708, 1645,
1530, 1499, 1421 cm⁻¹. [α]_D^{26.5}+69.5 ± 1.1° (c=1.001, MeOH) 元素分析
(C₂₃H₂₇NO₃S₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 59.61; H, 5.92; N, 3.02; S, 20.76 実測
10 値 (%) : C, 59.66; H, 5.90; N, 3.15; S, 20.52

化合物番号 1-80

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.54-
1.77(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.81(1H, m),
5.31-5.43(2H, m), 6.31(1H, d, J=7.2Hz), 7.37-7.44(3H, m), 7.61(1H, d, J=3.9Hz),
15 8.15(1H, dd, J=1.2 and 3.0Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3441, 3371, 3114, 1708, 1655,
1530, 1504, 1331, 1152 cm⁻¹. [α]_D^{26.5}+73.9 ± 1.1° (c=1.001, MeOH) 元素分析
(C₂₃H₂₇NO₃S₃ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 55.35; H, 5.57; N, 2.81; S, 19.28 実測
値 (%) : C, 55.47; H, 5.50; N, 2.80; S, 19.09

化合物番号 1-81

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.16-1.30(2H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.54-1.77
20 (4H, m), 1.98-2.17(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.46(3H, d, J=0.9Hz), 2.50(1H,
m), 3.79(1H, m), 5.29-5.41(2H, m), 5.99(1H, d, J=7.2 Hz), 6.67(1H, m), 6.99,
7.10 and 7.32(each 1H, each d, each J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3445, 3426,
2668, 1708, 1644, 1530, 1499, 1420, cm⁻¹. [α]_D^{26.5}+66.1 ± 1.1° (c=1.002, MeOH)
25 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₃S₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 60.37; H, 6.16; N, 2.93; S,
20.15 実測値 (%) : C, 60.21; H, 6.10; N, 2.90; S, 20.45

化合物番号 1-82

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.11(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.38-1.50(2H, m), 1.54-1.74
(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(4H, d and m, J=0.6Hz),
3.80(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.34(1H, d, J=6.6Hz), 6.77 (1H, m), 7.41, 7.55
and 7.58(each 1H, each d, each J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3511, 3442, 3373, 3096,
5 1708, 1655, 1530, 1504, 1436, 1335, 1152 cm⁻¹. [α]_D^{26.5}+73.0±1.1° (c=1.002,
MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₅S₃ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 56.18; H, 5.81; N,
2.73; S, 18.75 実測値 (%) : C, 56.26; H, 5.74; N, 2.65; S, 18.50

化合物番号 1-83

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.17(1H, m), 1.24-1.36(2H, m), 1.37-1.82(6H, m), 2.01-2.23
10 (5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.83(1H, m), 5.31-5.45 (2H, m),
7.17(1H, dd, J=3.9 and 5.4Hz), 7.36(1H, d, J=7.8Hz), 7.47 (1H, dd, J=1.5 and
3.9Hz), 7.66(1H, dd, J=1.5 and 5.4Hz). IR(CHCl₃): 3514, 3404, 3121, 1709,
1657, 1544, 1488, 1425 cm⁻¹. [α]_D²⁵+73.2±2.2° (c=0.518, MeOH) 元素分析
(C₂₂H₂₆N₂O₃S₃ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 56.67; H, 5.71; N, 6.01; S, 20.63 実測
15 値 (%) : C, 56.55; H, 5.71; N, 6.03; S, 20.93

化合物番号 1-84

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.43-1.48(2H, m), 1.57-
1.82(4H, m), 2.02(1H, d, J=3.3Hz), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J = 7.2 Hz),
2.55(1H, m), 3.86(1H, m), 4.01(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 6.17(1H, d, J=7.2Hz),
20 7.15-7.31(7H, m), 7.67(2H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3447, 2669, 1708,
1651, 1523, 1495 cm⁻¹. [α]_D²⁵+77.9±1.2° (c=1.016, MeOH) 元素分析
(C₂₈H₃₃NO₃) 計算値 (%) : C, 77.93; H, 7.71; N, 3.25 実測値 (%) : C, 77.65; H,
7.93; N, 3.32

化合物番号 1-85

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.08(1H, m), 1.21-1.31(2H, m), 1.44-1.49(2H, m), 1.58-
1.82(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.56(1H, m), 3.87(1H, m),
4.19(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.19(1H, d, J=7.2Hz), 6.80(1H, m), 6.93(1H, dd,

J=2.6 and 5.1Hz), 7.16(1H, dd, J=1.5 and 5.1Hz), 7.30 and 8.69(each 2H, each d, each J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3446, 2664, 1708, 1651, 1523, 1496 cm⁻¹.

[α]_D²⁵+73.2±1.1° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₃S) 計算値 (%) : C, 71.36; H, 7.14; N, 3.20; S, 7.33 実測値 (%) : C, 71.48; H, 7.05; N, 3.29; S, 7.13

5 化合物番号 1-86

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.43-1.48(2H, m), 1.58-1.81(4H, m), 2.00-2.17(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.55(1H, m), 3.87(1H, m), 3.98(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.19(1H, d, J=7.2Hz), 6.93-7.00(2H, m), 7.09-7.13(2H, m), 7.22 and 7.70(each 2H, each d, each J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3447, 2664, 1709, 1651, 1612, 1522, 1509, 1496, cm⁻¹. [α]_D²⁵+71.6±1.1° (c=1.019, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₂FNO₃) 計算値 (%) : C, 74.81; H, 7.17; N, 3.12; F, 4.23 実測値 (%) : C, 74.66; H, 7.19; N, 3.13; F, 4.10

化合物番号 1-87

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.08(1H, m), 1.20-1.31(2H, m), 1.44-1.49(2H, m), 1.58-1.82(4H, m), 2.00-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.56(1H, m), 3.87 (1H, m), 4.02(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.18(1H, d, J=7.2Hz), 6.88(1H, dd, J=1.5 and 4.8Hz), 6.92(1H, m), 7.25-7.28(3H, m), 7.68(2H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 2668, 1709, 1651, 1612, 1523, 1496 cm⁻¹. [α]_D²⁵+72.7±1.1° (c=1.014, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₃S·0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 71.07; H, 7.16; N, 3.18; S, 7.30 実測値 (%) : C, 70.90; H, 7.08; N, 3.21; S, 7.46

化合物番号 1-88

mp.103-105°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.58-1.81(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.82(1H, m), 4.16(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 5.97(1H, d, J=7.5 Hz), 6.79(1H, dt, J=0.9 and 3.9Hz), 6.96(1H, dd, J=1.5 and 4.8Hz), 7.05 (1H, m), 7.28(1H, dd, J=3.0 and 4.8Hz), 7.37(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3445, 3427, 2670, 1708, 1642, 1544, 1507 cm⁻¹. [α]_D²⁵+67.3±1.1° (c=1.002, MeOH) 元素分析

($C_{24}H_{29}NO_3S_2 \cdot 0.3H_2O$) 計算値 (%) : C, 64.20; H, 6.64; N, 3.12; S, 14.28 実測値 (%) : C, 64.29; H, 6.49; N, 3.10; S, 14.11

化合物番号 1-89

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.07(1H, m), 1.20-1.29(2H, m), 1.40-1.49(2H, m), 1.56-
5 1.89(4H, m), 2.00-2.25(5H, m), 2.32-2.38(2H, m), 2.51(1H, m), 3.80 (1H, m),
5.04(2H, s), 5.27-5.41(2H, m), 5.90(1H, d, $J=6.6Hz$), 6.38(1H, m), 6.63(1H, t,
 $J=2.4Hz$), 7.14-7.17(2H, m), 7.29-7.35(4H, m). IR($CHCl_3$): 3510, 3448, 2663,
1736, 1709, 1636, 1555, 1497 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+60.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分
析 ($C_{26}H_{32}N_2O_3 \cdot 0.3H_2O$) 計算値 (%) : C, 73.62; H, 7.70; N, 6.60 実測値 (%) :
10 C, 73.68; H, 7.62; N, 6.73

化合物番号 1-90

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.06(1H, m), 1.20-1.29(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.56-
1.87(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.32-2.38(2H, m), 2.50(1H, m), 3.80 (1H, m),
5.19(2H, s), 5.27-5.41(2H, m), 5.90(1H, d, $J=7.5Hz$), 6.37(1H, dd, $J=2.1$ and
15 3.0Hz), 6.67(1H, t, $J=2.4Hz$), 6.95-6.98(2H, m), 7.27(1H, dd, $J=1.8$ and 4.5Hz),
7.31(1H, dd, $J=1.8$ and 2.1Hz). IR($CHCl_3$): 3513, 3448, 2661, 1709, 1637, 1555,
1497 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+59.4 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($C_{24}H_{30}N_2O_3S \cdot$
0.2 H_2O) 計算値 (%) : C, 67.01; H, 7.12; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%) : C, 67.07;
H, 7.03; N, 6.62; S, 7.55

20 化合物番号 1-91

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.06(1H, m), 1.23-1.26(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.57-
1.82(4H, m), 2.00-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2Hz$), 2.50(1H, m), 3.82(1H, m),
5.03(2H, s), 5.27-5.42(2H, m), 5.98(1H, brs), 6.40(1H, m), 6.91(1H, dd, $J=1.2$
and 4.8Hz), 7.08(1H, brs), 7.28-7.31(2H, m). IR($CHCl_3$): 3516, 3448, 3108,
25 2663, 1736, 1709, 1636, 1555, 1497 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+59.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.008$, MeOH)
元素分析 ($C_{24}H_{30}N_2O_3S \cdot 0.2H_2O$) 計算値 (%) : C, 67.01; H, 7.12; N, 6.51; S, 7.45
実測値 (%) : C, 67.26; H, 7.06; N, 6.61; S, 7.55

化合物番号 I-92

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.38-1.43(2H, m), 1.54-1.78(4H, m), 1.96-2.23(5H, m), 2.36(2H, dt, $J=1.8$ and 6.9Hz), 2.52 (1H, m), 3.77(1H, m), 5.30-5.45(2H, m), 6.07(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.58(1H, dd, $J=1.5$ and 3.3Hz), 7.14(1H, dd, $J=2.1$ and 3.3Hz), 7.51-7.57(2H, m), 7.65 (1H, m), 7.77(1H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 7.88-7.92(2H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3444, 3144, 1732, 1708, 1651, 1570, 1509, 1382, 1176 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+55.9\pm0.9^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 63.08; H, 6.48; N, 5.88; S, 6.74 実測値 (%) : C, 63.24; H, 6.27; N, 6.03; S, 6.74

10 化合物番号 I-93

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.39-1.47(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 1.98-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.81(1H, m), 4.33(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 6.03(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.84(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.90(1H, m), 6.95(1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz), 7.19(1H, dd, $J=1.2$ and 5.1Hz), 7.38(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3554, 3427, 1708, 1643, 1544, 1507 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+70.1\pm1.1^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 64.72; H, 6.61; N, 3.14; S, 14.40 実測値 (%) : C, 64.83; H, 6.60; N, 3.31; S, 14.46

化合物番号 I-94

20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.20-1.27(2H, m), 1.40-1.44(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 2.00-2.19(5H, m), 2.36(2H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.78 (1H, m), 5.30-5.44(2H, m), 6.13(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.59(1H, dd, $J=1.5$ and 3.3Hz), 7.10(1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz), 7.16(1H, dd, $J=2.1$ and 3.3Hz), 7.69-7.76(3H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3444, 3143, 1708, 1651, 1571, 1508, 1387, 1179 cm^{-1} .
25 $[\alpha]_D^{24}+56.0\pm1.0^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 57.53; H, 5.96; N, 5.83; S, 13.35 実測値 (%) : C, 57.54; H, 6.07; N, 5.93; S, 12.91

化合物番号 1-95

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.16(1H, m), 1.26-1.37(2H, m), 1.40-1.81(6H, m), 2.04-2.25(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.87(1H, m), 5.32-5.46 (2H, m), 6.37(2H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 7.31(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.33(2H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 7.82(1H, m).
- 5 IR(CHCl_3): 3512, 3408, 3127, 1708, 1658, 1540, 1525, 1493, 1341 m^{-1} .
 $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+88.2\pm 1.3^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{N}_3\text{O}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 63.62; H, 6.60; N, 10.12; S, 7.72 実測値 (%) : C, 63.72; H, 6.45; N, 9.99; S, 7.75

化合物番号 1-96

- 10 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.57-1.78(4H, m), 2.01-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.80(1H, m), 5.30-5.43(2H, m), 6.11(1H, m), 6.98(1H, dd, $J=3.6$ and 5.4Hz), 7.24(1H, dd, $J=1.2$ and 3.6Hz), 7.38(1H, dd, $J=1.2$ and 5.4Hz), 7.43 (1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.85(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3445, 3108, 1708, 1650, 1535, 1498 m^{-1} .
- 15 $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+70.7\pm 1.1^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.15; H, 5.96; N, 3.00; S, 20.60 実測値 (%) : C, 59.06; H, 5.66; N, 3.07; S, 20.87

化合物番号 1-97

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.20-2.52(16H, m), 2.61(1H, m), 3.72(1H, m), 5.34-5.55 (2H, m), 6.66(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.12(1H, m), 7.71(1H, m), 7.75(1H, m), 8.29(1H, m), 8.37(1H, brs). IR(CHCl_3): 3512, 3405, 3096, 1726, 1710, 1653, 1542, 1505, 1402, 1329, 1152 m^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+65.4\pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 55.55; H, 5.55; N, 2.82; S, 19.35 実測値 (%) : C, 55.47; H, 5.54; N, 3.09; S, 19.21

25 化合物番号 1-98

mp.103-104°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.23-1.31(2H, m), 1.45-1.50(2H, m), 1.60-1.80(4H, m), 2.00-2.23(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55 (1H, m),

3.85(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.05(1H, d, J=7.5Hz), 6.98 and 7.04(each 1H, each d, each J=16.2Hz), 6.97(1H, d, J=3.9Hz), 7.25-7.33 (3H, m), 7.41(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3511, 3445, 3428, 2665, 1708, 1641, 1538, 1519, 1499 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 77.8 \pm 1.2^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₃S₂ · 0.25AcOEt)

5 計算値 (%) : C, 65.38; H, 6.54; N, 2.93; S, 13.43 実測値 (%) : C, 65.64; H, 6.62; N, 2.95; S, 13.26

化合物番号 I-99

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.20-1.30(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.59-1.80(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.80(1H, m),
10 5.30-5.43(2H, m), 5.94(1H, d, J=6.9Hz), 6.57(2H, s), 6.94(1H, d, J=3.9Hz), 7.03(1H, dd, J=1.5 and 4.5Hz), 7.29(1H, s), 7.30(1H, m), 7.34 (1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3511, 3445, 3427, 2670, 1708, 1642, 1536, 1518, 1500 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 62.8 \pm 1.0^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₃S₂ · 0.2AcOEt) 計算値 (%) : C, 65.48; H, 6.52; N, 2.96; S, 13.55 実測値 (%) : C, 65.36; H, 6.47; N, 2.13; S, 13.58

化合物番号 I-100

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.38-1.50(2H, m), 1.56-1.80 (4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.44(3H, d, J=0.9 Hz), 2.52(1H, m), 3.80(1H, m), 5.30-5.43(2H, m), 5.99(1H, d, J=7.5 Hz), 5.99(1H, d, J=7.5Hz),
20 6.70(1H, m), 7.03(1H, d, J=3.9Hz), 7.10(1H, d, J=1.5Hz), 7.36(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3445, 3426, 2671, 1708, 1644, 1530, 1499, 1420, 1318 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 69.1 \pm 1.1^\circ$ (c=1.018, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₃S₃) 計算値 (%) : C, 60.60; H, 6.14; N, 2.94; S, 20.22 実測値 (%) : C, 60.49; H, 6.26; N, 2.98; S, 20.25

化合物番号 I-101

25 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.38-1.50(2H, m), 1.54-1.77 (4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.47(3H, d, J=0.9 Hz), 2.53(1H, m), 3.81(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 6.30(1H, d, J=7.2 Hz), 7.03(1H, m), 7.42 and

7.59(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 7.90(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3517, 3441, 3370, 3115, 2671, 1708. 1655, 1530, 1504, 1442, 1328, 1156, 1142 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+71.6\pm 1.1^\circ$ ($c=1.018$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_5\text{S}_8 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 56.38; H, 5.80; N, 2.74; S, 18.81 実測値 (%) : C, 56.28; H, 5.74; N,

5 2.79; S, 18.92

化合物番号 I-102

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.09(1H, m), 1.21-1.28(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.57-1.74(4H, m), 2.00-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.82 (1H, m), 5.30-5.43(2H, m), 6.15(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.51 and 6.68(each 1H, each d, $J=11.7\text{Hz}$), 6.98(1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz), 7.06(1H, dd, $J=0.9$ and 3.9Hz), 7.13(1H, dt, $J=0.9$ and 3.6Hz), 7.25(1H, dd, $J=0.9$ and 5.1Hz), 7.41(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3445, 3427, 2665, 1708, 1643, 1535, 1501 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+68.6\pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 65.45; H, 6.45; N, 3.05; S, 13.98 実測値 (%) : C, 65.44; H, 6.37; N,

15 3.28; S, 13.82

化合物番号 I-103

mp.107-108°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.09(1H, m), 1.26-1.32(2H, m), 1.45-1.50 (2H, m), 1.60-1.81(4H, m), 2.01-2.23(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55 (1H, m), 3.84(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.03(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.97 and 7.14(each 1H, each d, $J=15.9\text{Hz}$), 6.97(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.01(1H, dd, $J=3.6$ and 5.4Hz), 7.08(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.23(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$), 7.40(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3517, 3445, 3428, 2670, 1708, 1641, 1536, 1518, 1500 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+85.0\pm 1.2^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.15\text{AcOEt}$) 計算値 (%) : C, 65.58; H, 6.49; N, 2.99; S, 13.68 実測値 (%) : C, 65.88; H, 6.74; N, 2.98; S, 13.35

25 化合物番号 I-104

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.07(1H, m), 1.19-1.30(2H, m), 1.42-1.50(2H, m), 1.57-1.79(4H, m), 2.01-2.24(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.82 (1H, m),

4.10(sH, s), 5.31-5.44(2H, m), 6.03(1H, d, J=7.2Hz), 6.70(1H, d, J=3.6Hz),
 6.95(1H, dd, J=3.6 and 5.4Hz), 7.03(1H, dd, J=1.5 and 3.6 Hz), 7.30(1H, d,
 J=3.6Hz), 7.36(1H, dd, J=1.5 and 5.4Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3445, 3427, 1708,
 1644, 1542, 1507 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24.5} + 65.0 \pm 1.0^\circ$ (c=1.008, MeOH) 元素分析
 5 (C₂₄H₂₉NO₃S₃ · 0.4H₂O) 計算値 (%): C, 59.69; H, 6.22; N, 2.90; S, 19.92 実測
 値 (%): C, 59.40; H, 5.98; N, 2.95; S, 20.06

化合物番号 I-105

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.11(1H, m), 1.21-1.31(2H, m), 1.42-1.49(2H, m), 1.58-
 1.76(4H, m), 2.01-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.81 (1H, m),
 10 4.60(sH, s), 5.32-5.45(2H, m), 6.18(1H, d, J=7.2Hz), 6.91(1H, d, J=3.9Hz),
 7.12(1H, dd, J=3.9 and 5.1Hz), 7.40(1H, d, J=3.9Hz), 7.52 (1H, dd, J=1.2 and
 3.9Hz), 7.72(1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3444, 3425, 3097, 1708,
 1648, 1524, 1508, 1402, 1328, 1147 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24.5} + 61.5 \pm 1.0^\circ$ (c=1.008, MeOH)
 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₅S₂ · 0.4H₂O) 計算値 (%): C, 55.98; H, 5.83; N, 2.72; S,
 15 18.68 実測値 (%): C, 55.77; H, 5.71; N, 2.84; S, 18.73

化合物番号 I-106

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.07(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.57-
 1.78(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.81 (1H, m),
 4.23(sH, s), 5.31-5.44(2H, m), 6.00(1H, d, J=7.2Hz), 6.82(1H, m), 6.88(1H, dd,
 20 J=3.6 and 5.1Hz), 6.92(1H, d, J=3.6Hz), 7.21(1H, dd, J= 1.2 and 5.1Hz),
 7.33(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3514, 3444, 3427, 2665, 1709, 1645, 1529,
 1498, 1421, 1317 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 67.1 \pm 1.1^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析
 (C₂₄H₂₉NO₃S₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 60.37; H, 6.16; N, 2.90; S, 20.15 実測
 値 (%): C, 60.46; H, 6.14; N, 2.96; S, 20.02

25 化合物番号 I-107

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.09-1.32(3H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.53-1.79(4H, m),
 1.96-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.54(4H, d and m, J=0.6Hz), 3.79 (1H,

m), 5.30-5.45(2H, m), 6.48 and 6.51(total 1H, each d, J=7.8 and 7.5 Hz), 7.12 (1H, dd, J=3.9 and 5.1Hz), 7.42 and 7.43(total 1H, each d, each J=3.9Hz), 7.52 and 7.53(total 1H, each d, each J=3.9Hz), 7.58(1H, m), 7.69 (1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz). IR(CHCl₃): 3509, 3443, 3425, 3092, 2666, 1708, 1650, 1532, 1503, 1403, 1322 cm⁻¹. [α]_D²³+70.4 ± 1.1 ° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₇NO₄S₃ · 0.4H₂O) 計算値 (%) : C, 56.97; H, 5.78; N, 2.89; S, 19.84 実測値 (%) : C, 57.03; H, 5.67; N, 3.19; S, 19.73

化合物番号 1-108

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.09-1.32(3H, m), 1.39-1.50(2H, m), 1.54-1.77(4H, m), 1.97-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52 and 2.53(total 3H, each s), 2.54(1H, m), 3.79(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.43 and 6.47(total 1H, each d, J=7.5 and 6.6Hz), 6.76(1H, m), 7.39(1H, t-like), 7.40(1H, dd, J=2.1 and 3.6Hz), 7.52(1H, dd, J=2.1 and 4.2Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3443, 3425, 3092, 1708, 1650, 1531, 1503, 1437, 1237 cm⁻¹. [α]_D²³+68.6±1.1° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₄S₃ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 58.20; H, 5.98; N, 2.83; S, 19.42 実測値 (%) : C, 58.18; H, 5.67; N, 2.90; S, 19.11

化合物番号 1-109

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.13(1H, m), 1.21-1.34(2H, m), 1.45-1.52(2H, m), 1.59-1.78(4H, m), 2.03-2.23(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2Hz), 2.58(1H, m), 3.86(1H, m), 5.32-5.46(2H, m), 6.28(1H, d, J=6.6Hz), 7.20(1H, dd, J=3.9 and 5.1Hz), 7.59(1H, d, J=3.9Hz), 7.75(1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz), 7.81(1H, d, J=3.9Hz), 7.92(1H, dd, J=1.2 and 3.9Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3442, 3425, 3109, 1709, 1651, 1622, 1529, 1508, 1442, 1414, 1356, 1286, 1267 cm⁻¹. [α]_D²³+89.2±1.3° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₇NO₄S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 62.50; H, 5.99; N, 3.04; S, 13.90 実測値 (%) : C, 62.63; H, 6.07; N, 2.97; S, 13.60

化合物番号 1-110

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.12(1H, m), 1.22-1.33(2H, m), 1.44-1.52(2H, m), 1.59-1.79

(4H, m), 2.03-2.24(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.57(1H, m), 3.87(1H, m),
 4.14(3H, s), 5.32-5.47(2H, m), 6.14(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.08(1H, dd, $J=3.9$ and
 5.4Hz), 7.27(1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz), 7.39(1H, dd, $J=1.2$ and 5.4Hz), 7.41(1H,
 d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.49(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3444, 3425, 2665, 1709,
 5 1649, 1529, 1498, 1049 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+73.3\pm 1.1^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析
 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 60.36; H, 6.32; N, 5.63; S, 12.89 実測
 値 (%) : C, 60.30; H, 6.14; N, 5.84; S, 12.95

化合物番号 I-111

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.19-1.30(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.55-
 10 1.82(4H, m), 1.98-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.83(1H, m),
 5.30-5.44(2H, m), 5.96(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.43(1H, br), 6.52 (1H, d, $J=3.9\text{Hz}$),
 6.90(1H, m), 7.08-7.11(2H, m), 7.26-7.32(3H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3444,
 3419, 1739, 1709, 1633, 1601, 1500, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22}+86.6\pm 1.3^\circ$ ($c=1.005$,
 MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 68.18; H, 6.91; N,
 15 6.36; S, 7.28 実測値 (%) : C, 68.11; H, 6.95; N, 6.43; S, 7.31

化合物番号 I-112

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-
 1.83(4H, m), 1.98-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.38 (3H, s),
 3.80(1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 5.82(1H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 6.15(1H, d, $J=4.2\text{Hz}$),
 20 7.11-7.39(6H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 3425, 1741, 1709, 1628, 1597, 1477,
 1415 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22}+83.2\pm 1.2^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_3\text{S}$) 計算
 値 (%) : C, 69.00; H, 7.13; N, 6.19; S, 7.08 実測値 (%) : C, 68.74; H, 7.08; N,
 6.15; S, 7.01

化合物番号 I-113

25 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.49(2H, m), 1.55-
 1.75(4H, m), 1.99-2.16(5H, m), 2.31(3H, s), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52 (1H, m),
 3.82(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.06(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.03-7.20 (5H, m),

7.44(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3444, 3425, 2671, 1709, 1647, 1529, 1498, 1421, 1317 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+70.2 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値(%) : C, 66.49; H, 6.65; N, 2.98; S, 13.65 実測値(%) : C, 66.34; H, 6.74; N, 2.94; S, 13.78

5 化合物番号 I-114

mp.114-116°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.37-1.47 (2H, m), 1.55-1.75(4H, m), 2.00-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.42 (3H, s), 2.52(1H, m), 3.80(1H, m), 5.30-5.43(2H, m), 6.23(1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.41(3H, m), 7.59(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.78(2H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3442, 3371, 2669, 1707, 1655, 1529, 1504, 1329, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+72.4 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値(%) : C, 62.25; H, 6.23; N, 2.79; S, 12.78 実測値(%) : C, 61.83; H, 6.39; N, 2.73; S, 12.78

化合物番号 I-115

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 1.99-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 3.77(3H, s), 3.82(1H, m), 5.31-5.43(2H, m), 6.06(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.74-6.89(3H, m), 7.16-7.23(2H, m), 7.45(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3444, 3425, 2665, 1709, 1647, 1591, 1529, 1498, 1477, 1423 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+68.7 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_2$) 計算値(%) : C, 64.30; H, 6.43; N, 2.88; S, 13.20 実測値(%) : C, 64.04; H, 6.56; N, 2.87; S, 13.43

化合物番号 I-116

mp.67-70°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.39-1.47 (2H, m), 1.55-1.75(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52 (1H, m), 3.80(1H, m), 3.86(3H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.26(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.12 (1H, m), 7.40-7.47(2H, m), 7.55(1H, m), 7.59(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3514, 3442, 3378, 1707, 1655, 1599, 1529, 1504, 1481, 1327, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+70.0 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_6\text{S}_2 \cdot 0.7\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%) : C, 58.89; H,

6.16; N, 2.64; S, 12.09 実測値 (%) : C, 58.87; H, 6.15; N, 2.74; S, 12.10

化合物番号 I-117

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10-1.32(3H, m), 1.37-1.46(2H, m), 1.55-1.73(4H, m),
1.94-2.18(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.55(1H, m), 3.78(1H, m), 5.29-5.45(2H,
5 m), 6.56(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.09(1H, m), 7.37(1H, t, $J=8.1\text{Hz}$), 7.45 (1H, d,
 $J=3.9\text{Hz}$), 7.47-7.53(2H, m), 7.55(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(KBr): 3365, 3095, 1707,
1628, 1543, 1448, 1306, 1147 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+70.8\pm 1.1^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分
析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_6\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 58.99; H, 5.86; N, 2.75; S, 12.60
実測値 (%) : C, 58.85; H, 5.85; N, 2.67; S, 12.77

10 化合物番号 I-118

mp.133-134°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.40-1.49
(2H, m), 1.55-1.78(4H, m), 1.96-2.24(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m),
3.81(1H, m), 5.31-5.46(2H, m), 6.14(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 6.71 (2H, m), 6.86(1H, m),
7.14(2H, m), 7.42(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3336, 3091, 2656, 1703, 1603,
15 1581, 1545 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+73.2\pm 1.1^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S}_2$)
計算値 (%) : C, 63.67; H, 6.20; N, 2.97; S, 13.60 実測値 (%) : C, 63.78; H, 6.17;
N, 3.10; S, 13.73

化合物番号 I-119

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.17-1.30(2H, m), 1.38-1.48(2H, m), 1.54-1.80
20 (4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.79 (3H, s),
3.81(1H, m), 4.10(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.97(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.77-6.84(4H,
m), 7.23(2H, m), 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3514, 3446, 3427, 1741,
1709, 1641, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22}+64.3\pm 1.0^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分
析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.08; H, 7.13; N, 2.98; S, 6.83 実測
25 値 (%) : C, 69.03; H, 7.25; N, 3.06; S, 7.00

化合物番号 I-120

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.16-1.28(2H, m), 1.36-1.46(2H, m), 1.52-1.78

(4H, m), 1.96-2.17(5H, m), 2.32(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.50(1H, m), 3.80(1H, m),
 4.02(2H, s), 5.28-5.42(2H, m), 6.16(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.72-6.77(4H, m), 7.14(1H,
 m), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3595, 3423, 3207, 1707, 1635, 1599, 1545,
 1508, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+66.8\pm 1.1^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S} \cdot$
 5 0.4 H_2O) 計算値 (%) : C, 67.77; H, 6.96; N, 3.04; S, 6.96 実測値 (%) : C, 67.83;
 H, 6.92; N, 3.18; S, 7.14

化合物番号 1-121

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.55-
 1.82(4H, m), 1.98-2.22(5H, m), 2.29(3H, s), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52 (1H, m),
 10 3.80(1H, m), 4.14(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 5.97(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.78 (1H,m),
 6.94-7.00(2H, m), 7.10(1H, m), 7.33(1H, m), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3):
 3514, 3446, 3427, 2669, 1763, 1745, 1709, 1643, 1545, 1506, 1371 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{23}+61.3\pm 1.0^\circ$ ($c=1.019$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値
 (%) : C, 67.61; H, 6.73; N, 2.82; S, 6.45 実測値 (%) : C, 67.52; H, 6.77; N, 2.99;
 15 S, 6.48

化合物番号 1-122

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.56-
 1.76(4H, m), 1.99-2.17(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.81(1H, m),
 4.25(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.00(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.81(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$),
 20 7.20-7.36(6H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 2667, 1709, 1643, 1543, 1506
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+65.0\pm 1.0^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計
 算値 (%) : C, 66.24; H, 6.67; N, 2.97; S, 13.60 実測値 (%) : C, 66.14; H, 6.63;
 N, 3.05; S, 13.49

化合物番号 1-123

25 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.40-1.50 (2H, m), 1.56-1.80
 (4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.54 (1H, m), 3.84 (1H, m),
 5.20(2H, s), 5.31-5.44(2H, m), 6.06(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.94-7.05 (4H, m), 7.27-

7.33(2H, m), 7.42(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3444, 3427, 2669, 1709, 1645, 1599, 1545, 1508, 1497 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 65.4 \pm 1.1^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.30; H, 6.92; N, 3.06; S, 7.01 実測値 (%) : C, 68.32; H, 6.83; N, 3.08; S, 6.99

5 化合物番号 1-124

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.55-1.80(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.81(1H, m), 4.51(2H, d, J=0.9Hz), 5.30-5.43(2H, m), 6.01(1H, d, J=7.5 Hz), 6.65-6.97(3H, m), 6.96(1H, d, J=3.9Hz), 7.16-7.21(1H, m), 7.41(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3444, 3427, 1709, 1643, 1603, 1545, 1504, 1309, 1260 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{22} + 65.7 \pm 1.0^\circ$ (c=1.014, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₂N₂O₃S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.45; H, 7.16; N, 6.14; S, 7.03 実測値 (%) : C, 68.43; H, 7.18; N, 6.27; S, 6.94

10 化合物番号 1-125

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.27(2H, m), 1.40-1.45(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 2.00-2.13(5H, m), 2.28(3H, s), 2.34(2H, t, J=7.5Hz), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m), 4.12(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.98(1H, d, J=7.2Hz), 6.69(1H, d, J=3.6Hz), 7.18(4H, s), 7.36(1H, d, J=3.6Hz). IR (CHCl₃): 3518, 3446, 3426, 1741, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{22.5} + 66.8 \pm 1.1^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₃S · H₂O) 計算値 (%) : C, 69.05; H, 7.51; N, 2.98; S, 6.83 実測値 (%) : C, 69.07; H, 7.11; N, 3.23; S, 7.04

20 化合物番号 1-126

化合物番号 1-126

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.17-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.55-1.77(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m), 4.12(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.91(1H, d, J=7.2Hz), 6.77(1H, d, J=3.3Hz), 6.86-6.90(2H, m), 7.15(1H, dd, J=1.8 and 7.5Hz), 7.20-7.26 (1H, m), 7.34(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3519, 3446, 3427, 2669, 1741, 1709, 1641, 1543, 1504, 1458, 1248 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{22.5} + 64.2 \pm 1.0^\circ$ (c=1.005, MeOH) 元素分析

25

($C_{27}H_{33}NO_4S \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C, 69.08; H, 7.13; N, 2.98; S, 6.83 実測値 (%) : C, 68.97; H, 6.90; N, 3.09; S, 6.77

化合物番号 I-127

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.04(1H, m), 1.18 (3H, t, $J=7.7Hz$), 1.15-1.29 (2H, m),
 5 1.41-1.46 (2H, m), 1.56-1.80 (4H, m), 2.00-2.15 (5H, m), 2.35 (2H, t, $J=7.2 Hz$),
 2.51 (1H, s), 2.64 (2H, q, $J=7.7Hz$), 3.80 (1H, m), 4.16 (2H, s), 5.29-5.41 (2H,
 m), 5.91 (1H, d, $J=7.5Hz$), 6.69 (1H, d, $J=3.6Hz$), 7.16-7.25 (4H, m), 7.35 (1H, d,
 $J=3.6Hz$). IR ($CHCl_3$): 3516, 3447, 3427, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1456
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{21}+65.8 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.011$, MeOH). 元素分析 ($C_{28}H_{35}NO_3S \cdot 0.2H_2O$) 計
 10 算値 (%) : C, 71.67; H, 7.60; N, 2.98; S, 6.83 実測値 (%) : C, 71.83; H, 7.49;
 N, 3.12; S, 6.89

化合物番号 I-128

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.04 (1H, m), 1.18-1.29 (2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.56-
 1.80 (4H, m), 2.00-2.20 (5H, m), 2.24 and 2.31 (each 3H, each s), 2.35 (2H, t,
 15 $J=7.4Hz$), 2.51 (1H, s), 3.80 (1H, m), 4.19 (2H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.91 (1H, d,
 $J=7.2Hz$), 6.70 (1H, d, $J=3.6Hz$), 6.99 (1H, d, $J=7.5Hz$), 7.00 (1H, s), 7.07 (1H,
 d, $J=7.5Hz$), 7.35 (1H, d, $J=3.6Hz$). IR ($CHCl_3$): 3514, 3446, 3426, 1741, 1709,
 1641, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{21}+65.2 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析
 ($C_{28}H_{35}NO_3S \cdot 0.2H_2O$) 計算値 (%) : C, 71.67; H, 7.60; N, 2.98; S, 6.83 実測値
 20 (%) : C, 71.53; H, 7.49; N, 3.31; S, 6.90

化合物番号 I-129

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.56-
 1.78(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.5Hz$), 2.43(3H, s), 2.52 (1H,
 s), 3.81(1H, m), 4.24(2H, s), 5.30-5.42(2H, m), 5.97(1H, d, $J=7.5 Hz$), 6.57(1H,
 25 m), 6.67(1H, d, $J=3.3Hz$), 6.83(1H, d, $J=3.9Hz$), 7.37 (1H, d, $J=3.9 Hz$).
 IR($CHCl_3$): 3514, 3446, 3427, 1709, 1643, 1545, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22}+67.1 \pm$
 1.1° ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($C_{25}H_{31}NO_3S_2$) 計算値 (%) : C, 65.61; H, 6.83;

N, 3.06; S, 14.01 実測値 (%) : C, 65.42; H, 6.76; N, 3.20; S, 13.73

化合物番号 I-130

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.45(2H, m), 1.55-1.78
(4H, m), 1.99-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.38(3H, s), 2.51 (1H, m),
5 3.80(1H, m), 4.09(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.96(1H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 6.76(1H, d,
 $J=3.6\text{Hz}$), 7.12(4H, s), 7.37(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3510, 3446, 3427,
1741, 1709, 1641, 1543, 1508, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22}+67.0\pm 1.1^\circ$ ($c=1.014$, MeOH)
元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 71.81; H, 7.36; N, 3.10; S, 7.10 実測値
(%) : C, 71.53; H, 7.24; N, 3.21; S, 7.36

10 化合物番号 I-131

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-
1.78(4H, m), 1.99-2.19(5H, m), 2.33(3H, s), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51 (1H, m),
3.81(1H, m), 4.09(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.96(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.77 (1H, d,
 $J=3.6\text{Hz}$), 7.02-7.07(3H, m), 7.21(1H, m), 7.37(1H, d, $J=3.6\text{ Hz}$). IR (CHCl_3):
15 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+66.1\pm 1.1^\circ$
($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 71.24; H,
7.40; N, 3.08; S, 7.04 実測値 (%) : C, 71.26; H, 7.20; N, 3.19; S, 7.12

化合物番号 I-132

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.19-1.30(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.57-
20 1.78(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.30(3H, s), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.52(1H, m),
3.81(1H, m), 4.25(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.01(1H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 6.82(1H, d,
 $J=3.9\text{Hz}$), 7.02(1H, m), 7.10-7.19(3H, m), 7.31(1H, d, $J=3.9\text{ Hz}$). IR(CHCl_3):
3516, 3446, 3427, 2671, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1475, 1456 cm^{-1} .
 $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+63.2\pm 1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値
25 (%) : C, 66.55; H, 6.91; N, 2.87; S, 13.16 実測値 (%) : C, 66.44; H, 6.87; N,
2.99; S, 13.11

化合物番号 I-133

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.20-1.30(2H, m), 1.45-1.51(2H, m), 1.56-1.82(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.82 (1H, m), 4.16(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 5.98(1H, d, J=7.2Hz), 6.13 (1H, dd, J=3.3 and 0.9Hz), 6.32(1H, dd, J=3.3 and 1.8Hz), 6.84(1H, d, J=3.6Hz), 7.35(1H, dd, J=1.8 and 0.9Hz), 7.37(1H, d, J=3.6Hz). IR (CHCl₃): 3512, 3446, 3427, 2669, 1709, 1643, 1545, 1506 cm⁻¹. [α]_D²² +69.6 ± 1.1 ° (c=1.015, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 66.86; H, 6.87; N, 3.25; S, 7.44 実測値 (%) : C, 66.75; H, 6.63; N, 3.32; S, 7.50

化合物番号 I-134

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.45-1.60(2H, m), 1.61-1.80(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.81(1H, m), 3.96(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.96(1H, d, J=6.9Hz), 6.30 (1H, m), 6.80(1H, m), 7.32(1H, m), 7.35-7.39(2H, m). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 2663, 1709, 1643, 1545, 1506 cm⁻¹. [α]_D²¹+70.2 ± 1.1 ° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₄S) 計算値 (%) : C, 67.42; H, 6.84; N, 3.28; S, 7.50 実測値 (%) : C, 67.13; H, 6.57; N, 3.40; S, 7.40

化合物番号 I-135

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.20-1.29(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.58-1.82(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m), 4.41(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.96(1H, d, J=7.2Hz), 6.91 (1H, d, J=3.6Hz), 7.11(1H, s), 7.25-7.35(3H, m), 7.39(1H, d, J=3.6Hz), 7.76 (1H, d, J=7.8Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3444, 3427, 2667, 1709, 1643, 1543, 1508 cm⁻¹. [α]_D²⁴+66.5 ± 1.1 ° (c=1.012, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂ · 0.5H₂O) 計算値 (%) : C, 66.90; H, 6.42; N, 2.79; S, 12.76 実測値 (%) : C, 66.99; H, 6.12; N, 2.81; S, 12.48

化合物番号 I-136

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.20-1.42(2H, m), 1.44-1.49(2H, m), 1.55-1.80(4H, m), 2.00-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m),

4.30(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.98(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.51 (1H, d, $J=0.6\text{Hz}$),
 6.92(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.17-7.25(2H, m), 7.38-7.51 (3H, m). IR (CHCl_3): 3514,
 3444, 3427, 2669, 1709, 1643, 1545, 1508, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+63.8\pm 1.0^\circ$
 (c=1.004, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.62; H,
 5 6.59; N, 2.90; S, 6.64 実測値 (%) : C, 69.51; H, 6.52; N, 2.92; S, 6.63

化合物番号 I-137

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.55-
 1.78(4H, m), 1.98-2.18(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.81(1H, m),
 4.17(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.98(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.81 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$),
 10 7.29-7.46(6H, m), 7.52-7.60(4H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3446, 3427, 1741, 1709,
 1643, 1543, 1506, 1489 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+59.4\pm 1.0^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析
 ($\text{C}_{32}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.30; H, 6.90; N, 2.71; S, 6.20 実測値
 (%) : C, 74.24; H, 6.78; N, 2.97; S, 6.16

化合物番号 I-138

15 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.04(1H, m), 1.17-1.29(2H, m), 1.39-1.47(2H, m), 1.54-
 1.76(4H, m), 1.97-2.38(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.80 (1H, m),
 4.19(2H, s), 5.28-5.41(2H, m), 5.98(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.79 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$),
 7.21(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.31-7.49(7H, m), 7.56(2H, m). IR (CHCl_3): 3512, 3446,
 3427, 2669, 1741, 1709, 1643, 1543, 1506, 1479, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+59.2\pm$
 20 1.0° (c=1.006, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.30;
 H, 6.90; N, 2.71; S, 6.20 実測値 (%) : C, 74.26; H, 6.92; N, 3.00; S, 6.20

化合物番号 I-139

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.05(1H, m), 1.17-1.32(2H, m), 1.43-1.48(2H, m), 1.58-
 1.80(4H, m), 2.02-2.24(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.58(1H, s), 3.91(1H,
 25 m), 4.11(2H, s), 5.30-5.44(2H, m), 6.11(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.18-7.30(6H, m),
 7.75(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.86(1H, s), 8.16(1H, s). IR(CHCl_3): 3516, 3430, 2665,
 1741, 1709, 1651, 1513, 1494, 1454, 1435 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+45.6\pm 0.9^\circ$ (c=1.004,

MeOH) 元素分析 ($C_{30}H_{33}NO_3S \cdot 0.1H_2O$) 計算値(%): C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55 実測値(%): C, 73.57; H, 6.71; N, 3.07; S, 6.30

化合物番号 I-140

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.09(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.58-
5 1.78(4H, m), 2.02-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.4Hz$), 2.60(1H, s), 3.92(1H, m), 4.10(2H, s), 5.32-5.46(2H, m), 6.14(1H, d, $J=7.2Hz$), 7.19-7.32(6H, m), 7.64(1H, s), 7.81(1H, s), 8.20(1H, d, $J=8.4Hz$). IR($CHCl_3$): 3516, 3438, 2669, 1709, 1651, 1516, 1494, 1406 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} +53.0 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($C_{30}H_{33}NO_3S$) 計算値(%): C, 73.89; H, 6.82; N, 2.87; S, 6.58 実測値(%):
10 C, 73.57; H, 7.05; N, 3.08; S, 6.63

化合物番号 I-141

mp.54-56°C; 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.97(1H, m), 1.10-1.43(4H, m), 1.53-1.72 (4H, m), 1.97-2.15(5H, m), 2.31(2H, t, $J=7.4Hz$), 2.45(1H, s), 3.83(1H, m), 4.39 and
15 4.52(each 1H, each d, $J=16.5Hz$), 5.25-5.40(2H, m), 5.98 (1H, d, $J=7.5Hz$), 7.00-7.31(7H, m), 7.57(1H, s), 7.73(1H, d, $J=7.5Hz$). IR ($CHCl_3$): 3514, 3433, 2671, 1709, 1655, 1512, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} +76.7 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($C_{30}H_{33}NO_3S \cdot 0.1H_2O$) 計算値(%): C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55 実測値(%): C, 73.45; H, 6.91; N, 3.21; S, 6.34

化合物番号 I-142

mp.118-119°C; 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.07(1H, m), 1.20-1.27(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.55-1.73(4H, m), 1.99-2.12(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5Hz$), 2.52(1H, s),
20 3.82(1H, m), 3.93(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 6.10 (1H, d, $J=7.2Hz$), 7.05(1H, d, $J=0.9Hz$), 7.16-7.32(6H, m). IR($CHCl_3$): 3516, 3444, 3429, 2669, 1739, 1709, 1665, 1549, 1508, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} +72.7 \pm 0.1.1^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($C_{28}H_{31}NO_3S$) 計算値(%): C, 71.36; H, 7.14; N, 3.20; S, 7.33 実測値(%): C,
25 71.31; H, 7.27; N, 3.36; S, 7.31

化合物番号 I-143

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.09(1H, m), 1.19-1.32(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.58-1.78(4H, m), 2.02-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60(1H, s), 3.92(1H, m), 4.24(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 6.14(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.18-7.30(6H, m), 7.43(1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.83(1H, s), 8.17(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3438, 2671, 1709, 1651, 1518, 1495, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 62.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.011$, MeOH)
 5 元素分析 ($\text{C}_{80}\text{H}_{83}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55
 実測値 (%): C, 73.52; H, 6.87; N, 3.13; S, 6.47

化合物番号 I-144

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.23-1.29(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.58-1.77(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m), 4.05(2H, s), 5.12(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.94(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.90-6.98(3H, m), 7.32-7.45 (6H, m). IR (CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1510, 1456, 1273 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23} + 53.7 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{83}\text{H}_{86}\text{FNO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 70.11; H, 6.49; N, 2.48; S, 5.67; F, 3.36 実測値 (%): C, 70.00; H, 6.44; N, 2.50; S, 5.75; F, 3.32
 15

化合物番号 I-145

mp. 136-137°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.23-1.29(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.58-1.77(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.78(1H, m), 4.05(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.93 (1H, d, $J=10.8\text{Hz}$), 6.77(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.88-6.98(3H, m), 7.36 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR (Nujol): 3377, 3101, 2752, 1703, 1618, 1601, 1550, 1518 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23} + 64.2 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{30}\text{FNO}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.23; H, 6.41; N, 2.97; S, 6.80; F, 4.03 実測値 (%): C, 66.15; H, 6.38; N, 2.94; S, 6.76; F, 3.94
 20

化合物番号 I-146

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.20-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.61-1.81(4H, m), 2.00-2.16(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.79 (1H, m), 4.03(2H, s), 5.08(2H, s), 5.29-5.40(2H, m), 5.63(1H, brs), 5.93 (1H, d, $J=7.5\text{Hz}$),
 25

6.70(1H, dd, J=2.1 and 8.4Hz), 6.77 (1H, d, J = 3.9Hz), 6.83 (1H, d, J=5.7Hz).
6.86(1H, d, J=8.4Hz), 7.36-7.41(6H, m). IR(CHCl₃): 3539, 3446, 3425, 1741,
1709, 1641, 1543, 1508, 1475, 1273 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +53.8 \pm 0.9^\circ$ (c=1.003, MeOH)
元素分析 (C₃₃H₃₇NO₅S · 0.5H₂O) 計算値 (%): C, 69.69; H, 6.73; N, 2.46; S, 5.64

5 実測値 (%): C, 69.68; H, 6.85; N, 2.68; S, 5.76

化合物番号 I-147

mp.150-151°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.06(1H, m), 1.20-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H,
m), 1.58-1.79(4H, m), 2.00-2.16(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m),
3.79(1H, m), 3.86(3H, s), 4.06(2H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.56 (1H, brs), 5.93(1H,
10 d, J=8.4Hz), 6.72-6.77(3H, m), 6.87 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.37(1H, d, J=3.6Hz).
IR(Nujol): 3452, 3361, 3130, 1743, 1707, 1620, 1599, 1550, 1522, 1286 cm⁻¹.
 $[\alpha]_D^{25} +62.6 \pm 1.0^\circ$ (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₅S) 計算値 (%): C,
67.05; H, 6.88; N, 2.90; S, 6.63 実測値 (%): C, 67.20; H, 7.04; N, 2.98; S, 6.58

化合物番号 I-148

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.07(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.41-1.50(2H, m), 1.56-1.81
(4H, m), 1.99-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 2.95-3.00 (2H,m),
3.10-3.15(2H, m), 3.83(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 6.02 (1H, d, J=7.2Hz), 6.70(1H,
d, J=3.9Hz), 7.15-7.32(5H, m), 7.33(1H, d, J=3.9 Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3446,
3429, 2671, 1741, 1709, 1641, 1543, 1506, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +68.4 \pm 1.1^\circ$
20 (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₅S · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 71.52; H,
7.38; N, 3.09; S, 7.07 実測値 (%): C, 71.35; H, 7.37; N, 3.19; S, 7.19

化合物番号 I-149

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.07(1H, m), 1.19-1.32(2H, m), 1.41-1.50(2H, m), 1.56-1.81
(4H, m), 1.99-2.23(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.43(3H, s), 2.53 (1H, m),
25 3.05-3.19(4H, m), 3.83(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 6.00(1H, d, J=6.9Hz), 6.23-
6.56(2H, m), 6.75 and 7.34(each 1H, each d, each J=3.6 Hz). IR (CHCl₃): 3510,
3446, 3429, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1458 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +64.6 \pm 1.0^\circ$

(c=1.014, MeOH) 元素分析 ($C_{26}H_{33}NO_3S_2 \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C, 65.96; H, 7.07; N, 2.96; S, 13.54 実測値 (%) : C, 65.87; H, 7.03; N, 3.02; S, 13.50

化合物番号 I-150

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.07(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.41-1.50(2H, m), 1.56-
 5 1.80(4H, m), 1.99-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.5Hz$), 2.53(1H, m), 3.18(3H, s),
 3.83(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 6.05(1H, d, $J=7.2Hz$), 6.74 (1H, d, $J=3.6Hz$),
 6.79(1H, m), 6.91(1H, dd, $J=3.6$ and $5.4Hz$), 7.13(1H, dd, $J=1.2$ and $5.4Hz$),
 7.34(1H, d, $J=3.6Hz$). IR($CHCl_3$): 3516, 3444, 3429, 2669, 1709, 1641, 1543,
 1506 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+66.1 \pm 1.0^\circ$ (c=1.019, MeOH) 元素分析 ($C_{25}H_{31}NO_3S_2$) 計算値
 10 (%) : C, 65.61; H, 6.83; N, 3.06; S, 14.01 実測値 (%) : C, 65.47; H, 6.89; N, 3.12;
 S, 13.82

化合物番号 I-151

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.09(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.42-1.51(2H, m), 1.57-
 1.81(4H, m), 2.00-2.22(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5Hz$), 2.56(1H, m), 2.99-3.05(2H,
 15 m), 3.11-3.17(2H, m), 3.88(1H, m), 5.30-5.44(2H, m), 6.22 (1H, d, $J=7.2Hz$),
 6.74(1H, m), 6.89(1H, dd, $J=3.3$ and $5.1Hz$), 7.11(1H, dd, $J=1.2$ and $5.1Hz$),
 7.23 and 7.67(each 2H, each d, each $J=8.1Hz$). IR ($CHCl_3$): 3516, 3448, 2665,
 1709, 1651, 1523, 1496 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+71.8 \pm 1.1^\circ$ (c=1.009, MeOH) 元素分析
 ($C_{27}H_{33}NO_3S$) 計算値 (%) : C, 71.81; H, 7.37; N, 3.10; S, 7.10 実測値 (%) : C,
 20 71.68; H, 7.40; N, 3.18; S, 6.96

化合物番号 I-152

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.07(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.42-1.50(2H, m), 1.56-
 1.81(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2Hz$), 2.53(1H, m), 2.92-2.97(2H,
 m), 3.07-3.12(2H, m), 3.83(1H, m), 5.31-5.44(2H, m), 5.99 (1H, d, $J=7.2Hz$),
 25 6.68(1H, d, $J=3.6Hz$), 6.92-7.00(2H, m), 7.08-7.15(2H, m), 7.32(1H, d, $J=3.6Hz$).
 IR($CHCl_3$): 3516, 3446, 3429, 1741, 1709, 1641, 1543, 1510, 1458 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{23}+64.1 \pm 1.0^\circ$ (c=1.012, MeOH) 元素分析 ($C_{27}H_{32}FNO_3S$) 計算値 (%) : C,

69.06; H, 6.87; N, 2.98; S, 6.88; F, 4.05 実測値 (%) : C, 68.92; H, 6.90; N, 3.03;
S, 6.81; F, 4.02

化合物番号 I-153

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-
5 1.78(4H, m), 2.00-2.19(5H, m), 2.29(6H, s), 2.34(2H, t, J=7.5Hz), 2.51(1H, m),
3.81(1H, m), 4.05(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.96(1H, d, J=7.5 Hz), 6.77(1H, td,
J=0.9 and 3.6Hz), 6.85(2H, s), 6.88(1H, s), 7.37 (1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃):
3516, 3446, 3427, 1739, 1709, 1641, 1606, 1543, 1506, 1458 cm⁻¹. [α]_D²³+64.6
±1.0° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₅NO₃S·0.1H₂O) 計算値(%): C, 71.94;
10 H, 7.59; N, 3.00; S, 6.86 実測値 (%) : C, 71.87; H, 7.52; N, 3.31; S, 6.94

化合物番号 I-154

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-1.78
(4H, m), 2.00-2.19(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.5Hz), 2.51(1H, m), 3.81(1H, m),
4.10(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.98(1H, d, J=7.2Hz), 6.75 (1H, td, J=0.9 and
15 3.9Hz), 6.97-7.03(2H, m), 7.17-7.22(2H, m), 7.36(1H, d, J = 3.9 Hz). IR(CHCl₃):
3512, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1508 cm⁻¹. [α]_D²⁴+66.1±1.1°
(c=1.008, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₀FNO₃S) 計算値 (%) : C, 68.54; H, 6.64; N,
3.07; S, 7.04; F, 4.17 実測値 (%) : C, 68.41; H, 6.70; N, 3.19; S, 6.90; F, 3.98

化合物番号 I-155

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.58-
20 1.78(4H, m), 2.00-2.17(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.5Hz), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m),
4.19(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.97(1H, d, J=7.8Hz), 6.75 (1H, td, J=0.9 and
3.6Hz), 7.34-7.37(3H, m), 7.56-7.59(2H, m). IR (CHCl₃): 3512, 3444, 3427, 1741,
1709, 1643, 1543, 1506, 1325, 1167, 1130, 1066 cm⁻¹. [α]_D²⁴+60.3±1.0°
25 (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₀F₃NO₃S) 計算値 (%) : C, 64.14; H, 5.98; N,
2.77; S, 6.34; F, 11.27 実測値 (%) : C, 64.16; H, 6.04; N, 3.02; S, 6.19; F, 11.17

化合物番号 I-156

mp.66-70°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.11(1H, m), 1.22-1.30(2H, m), 1.43-1.50(2H, m), 1.60-1.78(4H, m), 2.03-2.22(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.54(1H, m), 3.87(1H, m), 4.08(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.21 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.18-7.32(6H, m), 7.60(1H, d, $J=0.9\text{Hz}$), 7.70(1H, d, $J=0.6\text{Hz}$), 7.74 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$). IR(KBr): 3338, 1707, 1616, 1556, 1537 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +97.2 \pm 1.4^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 73.08; H, 6.87; N, 2.84; S, 6.50 実測値 (%): C, 73.19; H, 7.11; N, 2.98; S, 6.32

化合物番号 I-157

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.03(1H, m), 1.17-1.29(2H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.55-1.76(4H, m), 1.97-2.18(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.50(1H, m), 3.80 (1H, m), 4.29(2H, s), 5.28-5.40(2H, m), 5.94(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.81 (1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.32-7.39(2H, m), 7.42-7.50(2H, m), 7.69(1H, s), 7.77-7.83 (3H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 2665, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +62.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{32}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 73.35; H, 6.85; N, 2.85; S, 6.53 実測値 (%): C, 73.36; H, 6.84; N, 3.19; S, 6.55

化合物番号 I-158

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.20-1.32(2H, m), 1.42-1.50(2H, m), 1.57-1.84 (4H, m), 2.00-2.23(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 2.95-3.00(2H, m), 3.06-3.12(2H, m), 3.82(1H, m), 3.83(3H, s), 5.30-5.43 (2H, m), 5.95(1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 6.73(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.84-6.89(2H, m), 7.09 (1H, dd, $J=1.5$ and 7.5Hz), 7.20(1H, dt, $J=1.5$ and 7.5Hz), 7.34(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(Nujol): 3367, 3221, 3186, 3091, 3055, 2654, 1711, 1631, 1566, 1541, 1321 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +61.3 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 69.82; H, 7.32; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%): C, 69.93; H, 7.48; N, 3.09; S, 6.54

25 化合物番号 I-159

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.54-1.78(4H, m), 1.98-2.21(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.53(1H, m), 2.94-3.03 (2H,

m), 3.06-3.15(2H, m), 3.83(1H, m), 5.29-5.43(2H, m), 6.12 (1H, d, J=7.5Hz),
 6.72(1H, d, J=3.6Hz), 6.77-6.83(2H, m), 7.04-7.08(2H, m), 7.36(1H, d, J=3.6Hz).
 IR(CHCl₃): 3599, 3444, 3425, 3195, 1709, 1635, 1543, 1508, 1456 cm⁻¹.
 [α]_D²⁵+64.8±1.0° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₄S · 0.2H₂O) 計算値
 5 (%) : C, 68.82; H, 7.14; N, 2.97; S, 6.80 実測値 (%) : C, 68.81; H, 7.10; N, 3.03;
 S, 6.88

化合物番号 I-160

mp.139-141°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.12(1H, m), 1.25-1.31(2H, m), 1.45-1.51(2H,
 m), 1.60-1.78(4H, m), 2.02-2.22(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.5Hz), 2.57 (1H, m),
 10 3.87(1H, m), 4.09(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.22 (1H, d, J=7.2 Hz), 7.19-7.33(6H,
 m), 7.63(1H, m), 7.71(1H, d, J=8.7Hz), 7.73(1H, s). IR (KBr): 3338, 1705, 1616,
 1560, 1537 cm⁻¹. [α]_D²⁵+92.1±1.3° (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₃NO₃S)
 計算値 (%) : C, 73.89; H, 6.82; N, 2.87; S, 6.58 実測値 (%) : C, 73.69; H, 6.75;
 N, 2.91; S, 6.58

15 化合物番号 I-161

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.12(1H, m), 1.25-1.31(2H, m), 1.47-1.51(2H, m), 1.60-
 1.76(4H, m), 2.03-2.20(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.57(1H, m), 3.87 (1H, m),
 4.08(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.22(1H, d, J=7.5Hz), 6.90 (1H, dd, J=1.2 and
 4.8Hz), 6.93(1H, m), 7.25-7.29(2H, m), 7.61 and 7.71 (each 1H, each s),
 20 7.75(1H, d, J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3444, 3423, 2671, 1709, 1649, 1531,
 1502 cm⁻¹. [α]_D²⁵+96.1±1.4° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂) 計算
 値 (%) : C, 68.12; H, 6.33; N, 2.84; S, 12.99 実測値 (%) : C, 67.89; H, 6.32; N,
 2.88; S, 12.88

化合物番号 I-162

25 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.12(1H, m), 1.24-1.31(2H, m), 1.45-1.51(2H, m), 1.60-
 1.78(4H, m), 2.03-2.22(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.2Hz), 2.57(1H, m), 3.87(1H, m),
 4.25(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.25(1H, d, J=7.2Hz), 6.81 (1H, m), 6.93(1H, dd,

J=3.3 and 5.4Hz), 7.15(1H, dd, J=1.5 and 5.4Hz), 7.31 (1H, dd, J=1.5 and 8.1Hz), 7.65 and 7.71(each 1H, each s), 7.76(1H, d, J = 8.1 Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3444, 3423, 1741, 1709, 1649, 1531, 1502 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 98.5 \pm 1.4^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂ · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 67.87; H, 6.35; N, 2.83; S, 12.94 実測値 (%): C, 67.83; H, 6.29; N, 3.00; S, 12.99

化合物番号 I-163

mp.114-115°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.09(1H, m), 1.20-1.30(2H, m), 1.40-1.49 (2H, m), 1.55-1.77(4H, m), 1.99-2.19(5H, m), 2.34(2H, t, J = 7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.83(1H, m), 4.12(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.14 (1H, d, J=7.5 Hz), 6.81 and 6.93(each 1H, each m), 7.14-7.17(2H, m), 7.37(1H, d, J=1.8 Hz). IR (CHCl₃): 3516, 3444, 3428, 2671, 1709, 1645, 1550, 1508, 1435 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 71.6 \pm 1.1^\circ$ (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₃S₂ · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 64.72; H, 6.61; N, 3.14; S, 14.40 実測値 (%): C, 64.50; H, 6.54; N, 3.24; S, 14.45

化合物番号 I-164

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.08(1H, m), 1.20-1.31(2H, m), 1.41-1.49(2H, m), 1.56-1.77(4H, m), 1.99-2.19(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.83(1H, m), 3.94(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.08(1H, d, J=6.9Hz), 6.91 and 6.95 (each 1H, each m), 7.08(1H, d, J=1.5Hz), 7.27(1H, m), 7.34(1H, d, J=1.5 Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3444, 3429, 1739, 1709, 1644, 1550, 1508 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 69.7 \pm 1.1^\circ$ (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₄H₂₉NO₃S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%): C, 64.45; H, 6.63; N, 3.13; S, 14.34 実測値 (%): C, 64.37; H, 6.49; N, 3.16; S, 14.41

化合物番号 I-165

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.08(1H, m), 1.19-1.31(2H, m), 1.41-1.51(2H, m), 1.55-1.74(4H, m), 1.99-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.53(1H, m), 3.73(2H, s), 3.83(1H, m), 5.30-5.42(2H, m), 6.15(1H, d, J=6.6Hz), 6.25, 7.10 and 7.24(each 1H, each s), 7.35-7.38(2H, m). IR(CHCl₃): 3510, 3444, 3429, 2669, 1709, 1645, 1550, 1508 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 71.6 \pm 1.1^\circ$ (c=1.008, MeOH) 元素分析

(C₂₄H₂₉NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 66.85; H, 6.78; N, 3.25; S, 7.44 実測値 (%) : C, 66.94; H, 6.81; N, 3.26; S, 7.38

化合物番号 1-166

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.02(1H, m), 1.15-1.27(2H, m), 1.36-1.45(2H, m), 1.53-
5 1.76(4H, m), 1.96-2.14(5H, m), 2.32(2H, t, J=7.2Hz), 2.49(1H, m), 3.78 (1H, m),
4.58(2H, s), 5.27-5.39(2H, m), 5.92(1H, d, J=7.2Hz), 6.73 and 7.32(each 1H,
each d, each J=3.9Hz), 7.37-7.51(4H, m), 7.80(1H, d, J=7.5 Hz), 7.87 and
7.97(each 1H, each m). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 2669, 1739, 1709, 1641,
1543, 1508, 1458 cm⁻¹. [α]_D^{25.5}+62.8 ± 1.0° (c=1.012, MeOH) 元素分析
10 (C₃₀H₃₃NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55 実測値
(%) : C, 73.35; H, 6.54; N, 3.06; S, 6.51

化合物番号 1-167

mp.129-130°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.16-1.28(2H, m), 1.38-1.46(2H,
m), 1.54-1.73(4H, m), 1.97-2.15(5H, m), 2.31(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m),
15 3.81(1H, m), 4.37(2H, s), 5.28-5.41(2H, m), 6.04 (1H, d, J=7.5Hz), 6.97(1H, s),
7.30-7.50(5H, m), 7.77(1H, d, J=8.1Hz), 7.86 and 7.94(each 1H, each m).
IR(CHCl₃): 3514, 3444, 3427, 1739, 1709, 1645, 1549, 1508 cm⁻¹. [α]_D²⁴+59.4 ±
1.0° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₃NO₃S) 計算値 (%) : C, 73.89; H, 6.82;
N, 2.87; S, 6.58 実測値 (%) : C, 73.85; H, 6.90; N, 2.85; S, 6.81

20 化合物番号 1-168

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.21-1.33(2H, m), 1.47-1.52(2H, m), 1.59-1.80
(4H, m), 2.04-2.27(5H, m), 2.36(2H, t, J=7.5Hz), 2.61(1H, m), 3.93(1H, m),
4.42(2H, s), 5.33-5.47(2H, m), 6.13(1H, d, J=7.5Hz), 6.88 (1H, m), 6.92(1H, m),
7.15(1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz), 7.28(1H, d, J=7.5Hz), 7.43 (1H, d, J=8.1Hz),
25 7.84(1H, s), 8.20(1H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3438, 1709, 1651, 1518,
1495 cm⁻¹. [α]_D²⁵+61.6 ± 1.0° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂) 計算
値 (%) : C, 68.12; H, 6.33; N, 2.84; S, 12.99 実測値 (%) : C, 67.83; H, 6.28; N,

2.96; S, 12.76

化合物番号 1-169

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10(1H, m), 1.22-1.32(2H, m), 1.46-1.51(2H, m), 1.58-1.76(4H, m), 2.02-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60(1H, m), 3.92 (1H, m),
 5 4.23(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 6.18(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.92 (1H, dd, $J=1.2$ and 4.8Hz), 7.01(1H, m), 7.20-7.25(2H, m), 7.41(1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.84(1H, s), 8.18(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3510, 3438, 2667, 1709, 1651, 1518, 1495 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+61.3 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 68.12; H, 6.33; N, 2.84; S, 12.99 実測値 (%) : C, 67.94; H, 6.30; N,
 10 2.97; S, 12.87

化合物番号 1-170

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.10(1H, m), 1.21-1.33(2H, m), 1.47-1.52(2H, m), 1.59-1.79(4H, m), 2.03-2.27(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.61(1H, m), 3.93 (1H, m), 4.03(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 6.15(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.23 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$),
 15 7.29(1H, m), 7.35(1H, t, $J=1.5\text{Hz}$), 7.42(1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.85 (1H, s), 8.18(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3518, 3438, 2663, 1739, 1709, 1651, 1518, 1496 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+60.3 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 70.15; H, 6.56; N, 2.92; S, 6.69 実測値 (%) : C, 70.03; H, 6.49; N, 2.92; S, 6.69

20 化合物番号 1-171

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-1.79(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.45(3H, s), 2.50(1H, m), 3.80(1H, m), 4.25(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.95(1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 6.78(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.11-7.27(4H, m), 7.36(1H, d, $J = 3.6\text{ Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3446,
 25 3427, 2669, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23.5}+62.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 67.05; H, 6.88; N, 2.90; S, 13.26 実測値 (%) : C, 66.94; H, 7.05; N, 3.00; S, 13.14

化合物番号 1-172

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.57-1.78(4H, m), 2.01-2.19(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 2.90(3H, s), 3.80(1H, m), 4.68(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 6.02(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.84(1H, td, $J=0.9$ and 3.9Hz), 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.42-7.51 (2H, m), 7.62(1H, dt, $J=1.5$ and 7.5Hz), 8.08(1H, dd, $J=1.5$ and 7.5Hz). IR(CHCl_3): 3518, 3444, 3427, 1709, 1643, 1543, 1508, 1311, 1153 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{28.5} + 59.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 62.45; H, 6.48; N, 2.70; S, 12.35 実測値 (%) : C, 62.47; H, 6.60; N, 2.73; S, 12.36

10 化合物番号 1-173

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13(1H, m), 1.23-1.36(2H, m), 1.43-1.80(6H, m), 2.03-2.24(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60(1H, m), 3.91(1H, m), 3.93 (2H, s), 5.31-5.46(2H, m), 6.31(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.32-7.42(2H, m), 7.57 (1H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 7.73-7.82(3H, m), 7.94(1H, s). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 2665, 1709, 1649, 1616, 1514, 1481, 1468 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 100.7 \pm 1.4^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 77.64; H, 7.31; N, 3.23 実測値 (%) : C, 77.64; H, 7.57; N, 3.29

化合物番号 1-174

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.19-1.28(2H, m), 1.40-1.47(2H, m), 1.57-1.78(4H, m), 1.99-2.18(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.21(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 3.81(1H, m), 4.01(2H, s), 4.58(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 5.29-5.42 (2H, m), 6.02(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.80(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.06(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 7.18(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3512, 3446, 3427, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1477, 1460, 1173 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 53.8 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{32}\text{BrNO}_4\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 60.02; H, 5.79; Br, 14.26; N, 2.50; S, 5.72 実測値 (%) : C, 59.87; H, 5.68; Br, 14.13; N, 2.59; S, 5.71

化合物番号 1-175

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.12(1H, m), 1.23-1.31(2H, m), 1.44-1.51(2H, m), 1.60-1.78(4H, m), 2.03-2.28(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.56(1H, s), 3.87(1H, m), 4.21(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.21(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.18-7.37(7H, m), 7.70(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.80(1H, s). IR(CHCl_3): 3514, 3444, 3423, 2667, 1709, 1649, 1537, 1502, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+78.2\pm 1.2^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{33}\text{BrNO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 73.62; H, 6.84; N, 2.86; S, 6.55 実測値 (%) : C, 73.49; H, 6.88; N, 2.89; S, 6.57

化合物番号 I-176

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.12(1H, m), 1.23-1.32(2H, m), 1.44-1.51(2H, m), 1.61-1.78(4H, m), 2.03-2.28(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.57(1H, s), 3.88 (1H, m), 4.21(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.22(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.94 (1H, dd, $J=1.5$ and 4.8Hz), 7.04(1H, m), 7.21-7.25(2H, m), 7.35(1H, dd, $J=7.2$ and 7.8Hz), 7.71(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.80(1H, s). IR(CHCl_3): 3512, 3444, 3423, 2669, 1709, 1647, 1539, 1504 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+77.1\pm 1.2^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.63; H, 6.36; N, 2.82; S, 12.90 実測値 (%) : C, 67.57; H, 6.34; N, 2.97; S, 12.98

化合物番号 I-177

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.12(1H, m), 1.25-1.32(2H, m), 1.44-1.51(2H, m), 1.60-1.78(4H, m), 2.03-2.28(5H, m), 2.31(3H, s), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56 (1H, s), 3.87(1H, m), 4.17(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.22(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.09 and 7.15(each 2H, each d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.19(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.34(1H, dd, $J=7.2$ and 7.8Hz), 7.69(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.79(1H, s). IR (CHCl_3): 3510, 3444, 3423, 2669, 1709, 1647, 1537, 1504 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+75.9\pm 1.2^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 74.22; H, 7.03; N, 2.79; S, 6.39 実測値 (%) : C, 73.93; H, 7.13; N, 2.91; S, 6.38

化合物番号 I-178

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.13(1H, m), 1.24-1.31(2H, m), 1.44-1.51(2H, m), 1.60-

1.77(4H, m), 2.03-2.22(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.56(1H, s), 3.88(1H, m), 4.39(2H, s), 5.31-5.45(2H, m), 6.26(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.90-6.94(2H, m), 7.15(1H, dd, $J=1.5$ and 5.1Hz), 7.27(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.36 (1H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 7.71(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.80(1H, s). IR(CHCl_3): 3510, 3444, 3423, 2667, 1709, 1649, 1537, 1504 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+76.6 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 68.12; H, 6.33; N, 2.84; S, 12.99 実測値 (%) : C, 67.83; H, 6.45; N, 3.04; S, 13.03

化合物番号 1-179

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.39-1.47(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 1.98-2.18(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.50(1H, m), 3.80(1H, m), 4.08(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.95(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.53 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.23-7.41(10H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1641, 1543, 1506, 1479, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24.5}+57.6 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.30; H, 6.90; N, 2.71; S, 6.20 実測値 (%) : C, 74.24; H, 6.89; N, 2.88; S, 6.47

化合物番号 1-180

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.17(1H, m), 1.24-1.35(2H, m), 1.48-1.55(2H, m), 1.61-1.79(4H, m), 2.06-2.26(5H, m), 2.37(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.61(1H, m), 3.90 (1H, m), 5.33-5.48(2H, m), 6.44(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.31(1H, m), 7.47-7.65 (5H, m), 7.90(1H, s). IR(CHCl_3): 3516, 3440, 1714, 1655, 1604, 1514, 1473, 1446 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+92.1 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{29}\text{NO}_4 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.91; H, 6.65; N, 3.12 実測値 (%) : C, 74.81; H, 6.51; N, 3.29

化合物番号 1-181

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.55-1.77(4H, m), 1.99-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.79(3H, s), 3.80(1H, m), 4.08(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.97(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.75(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.85 and 7.15(each 2H, each d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$).

IR(CHCl₃): 3518, 3446, 3427, 1741, 1709, 1641, 1612, 1543, 1510, 1458 cm⁻¹.

[α]_D²⁵+63.6±1.0° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.88; H, 7.14; N, 2.97; S, 6.80 実測値 (%) : C, 68.92; H, 7.02; N, 3.12; S, 6.96

5 化合物番号 I-182

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.18-1.27(2H, m), 1.40-1.45(2H, m), 1.59-1.78(4H, m), 1.99-2.14(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.4Hz), 2.51(1H, s), 3.80 (1H, m), 4.37(2H, s), 5.29-5.41(2H, m), 5.97(1H, d, J=7.2Hz), 6.82 (1H, d, J=3.6Hz), 7.20(1H, s), 7.34-7.37(3H, m), 7.69(1H, m), 7.86(1H, m). IR (CHCl₃): 3512, 3444, 3427, 2669, 1709, 1643, 1543, 1508, 1458, 1431 cm⁻¹. [α]_D²⁵+60.7±1.0° (c=1.008, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 67.39; H, 6.38; N, 2.81; S, 12.85 実測値 (%) : C, 67.44; H, 6.30; N, 3.15; S, 12.81

化合物番号 I-183

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.18-1.26(2H, m), 1.39-1.44(2H, m), 1.54-1.75(4H, m), 1.99-2.15(5H, m), 2.32(2H, t, J=7.4Hz), 2.50(1H, s), 3.80 (1H, m), 4.12(2H, s), 5.28-5.42(2H, m), 6.05(1H, d, J=7.5Hz), 6.78 (1H, d, J=3.9 Hz), 6.82-6.87(2H, m), 7.07-7.14(2H, m), 7.35(1H, d, J=3.9 Hz). IR (CHCl₃): 3508, 3444, 3197, 1707, 1635, 1543, 1508, 1456 cm⁻¹. [α]_D²⁵ +64.7±1.0° (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.30; H, 6.92; N, 3.06; S, 7.01 実測値 (%) : C, 68.21; H, 6.96; N, 3.09; S, 6.93

化合物番号 I-184

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.15(1H, m), 1.26-1.35(2H, m), 1.47-1.56(2H, m), 1.62-1.82(4H, m), 2.05-2.26(5H, m), 2.37(2H, t, J=7.2Hz), 2.61(1H, m), 3.92(1H, m), 3.93(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 6.34(1H, d, J=6.9Hz), 7.31-7.43 (2H, m), 7.53-7.59(2H, m), 7.67(1H, m), 7.5(1H, d, J=6.9Hz), 8.17 (1H, s). IR(CHCl₃): 3514, 3444, 2667, 1709, 1651, 1572, 1516, 1481, 1452 cm⁻¹. [α]_D²⁴+81.2±1.2° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 77.64; H, 7.31;

N, 3.23 実測値 (%) : C, 77.59; H, 7.15; N, 3.44

化合物番号 I-185

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.21-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.58-1.78(4H, m), 2.00-2.16(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.79 (1H, m),
5 4.16(2H, s), 5.31-5.40(2H, m), 5.93(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.80 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$),
7.03-7.12(2H, m), 7.20-7.28(2H, m), 7.35(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3518,
3444, 3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+56.2\pm0.9^\circ$ ($c=1.03$,
 CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{30}\text{FNO}_3\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.48; H, 6.71; N,
3.03; S, 6.93; F, 4.11 実測値 (%) : C, 67.49; H, 6.72; N, 3.09; S, 6.93; F, 4.11

10 化合物番号 I-186

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.58-1.82(4H, m), 2.00-2.16(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.80(1H, m),
4.17(2H, s), 5.08(2H, s), 5.28-5.41(2H, m), 5.90(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$),
6.90-6.95(2H, m), 7.18-7.25(2H, m), 7.31-7.38 (6H, m). IR(CHCl_3):
15 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1641, 1601, 1543, 1502, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+53.9$
 $\pm0.9^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{33}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 72.90; H, 6.86;
N, 2.58; S, 5.90 実測値 (%) : C, 72.64; H, 6.92; N, 2.52; S, 5.74

化合物番号 I-187

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.57-1.78(4H, m),
20 1.99-2.15(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.80 (1H, m),
4.16(2H, s), 4.54-4.57(2H, m), 5.24-5.41(4H, m), 5.94(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$),
6.04(1H, m), 6.79(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.85-6.93(2H, m), 7.15-7.24 (2H, m),
7.34(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 1739, 1709, 1641, 1543,
1506, 1477 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+59.0\pm1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S} \cdot$
25 $0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 70.05; H, 7.18; N, 2.82; S, 6.45 実測値 (%) : C, 69.97;
H, 7.16; N, 2.80; S, 6.52

化合物番号 I-188

mp.84-85°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.18-1.29(2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.56-1.81(4H, m), 2.00-2.17(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51 (1H, s), 3.80(1H, m), 4.07(2H, s), 5.05(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.93 (1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.75(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.92 and 7.15(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.31-7.44(6H, m). IR(CHCl_3): 3521, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1612, 1543, 1510, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+56.1 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{33}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 72.90; H, 6.86; N, 2.58; S, 5.90 実測値 (%): C, 72.78; H, 6.88; N, 2.74; S, 5.84
化合物番号 1-189

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-1.79(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.80 (1H, m), 4.07(2H, s), 4.51-4.53(2H, m), 5.26-5.44(4H, m), 5.94(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.05(1H, m), 6.76(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.87 and 7.14(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1612, 1543, 1508, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+61.6 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 69.54; H, 7.20; N, 2.78; S, 6.40 実測値 (%): C, 69.47; H, 7.22; N, 2.84; S, 6.51
化合物番号 1-190

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-1.80(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.81(1H, m), 4.04(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.93(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.68-6.78(2H, m), 7.36(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3517, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1504, 1489, 1444, 1250, 1041 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+59.4 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 67.34; H, 6.49; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%): C, 67.27; H, 6.45; N, 3.04; S, 6.63
化合物番号 1-191

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-1.80(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.81 (1H, m),

4.12(2H, s), 5.30-5.42(2H, m), 6.04(1H, d, J=7.2Hz), 6.77 (1H, d, J=3.6Hz),
6.89-7.04(3H, m), 7.28(1H, m), 7.38(1H, d, J = 3.6 Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3446,
3427, 1739, 1709, 1643, 1545, 1506 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +62.6 \pm 1.0^\circ$ (c=1.009, MeOH)
元素分析 (C₂₆H₈₀FNO₃S) 計算値 (%): C, 68.54; H, 6.64; N, 3.07; S, 7.04; F, 4.17

5 実測値 (%): C, 68.25; H, 6.37; N, 3.19; S, 7.12; F, 4.12

化合物番号 1-192

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.06(1H, m), 1.18-1.32(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.54-
1.80(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.5Hz), 2.52(1H, m), 3.81(1H, m),
4.19(2H, s), 5.30-5.42(2H, m), 5.99(1H, d, J=7.2Hz), 6.78 and 7.37(each 1H,
10 each d, each J=3.6Hz), 7.40-7.54(4H, m). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 1740,
1709, 1643, 1545, 1506, 1450, 1330, 1167, 1130, 1074 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +55.4 \pm 0.9^\circ$
(c=1.029, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₀F₃NO₃S) 計算値 (%): C, 64.14; H, 5.98; N,
2.77; S, 6.34; F, 11.27 実測値 (%): C, 63.95; H, 5.99; N, 2.90; S, 6.36; F, 10.98

化合物番号 1-193

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.05(1H, m), 1.24-1.28(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.58-
1.79(4H, m), 2.01-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.80 (1H, m),
4.26(2H, s), 5.33-5.38(2H, m), 5.94(1H, d, J=7.2Hz), 6.79 (1H, d, J=3.9Hz),
7.21-7.28(3H, m), 7.35-7.40(2H, m). IR(CHCl₃): 3518, 3446, 3427, 1743, 1709,
1643, 1543, 1506 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +55.5 \pm 0.9^\circ$ (c=1.06, CHCl₃) 元素分析
20 (C₂₆H₃₀ClNO₃S · 0.3H₂O) 計算値 (%): C, 65.41; H, 6.46; N, 2.93; S, 6.72; Cl,
7.43 実測値 (%): C, 65.41; H, 6.40; N, 3.08; S, 6.75; Cl, 7.31

化合物番号 1-194

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.04(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.39-1.46(2H, m), 1.56-1.78
(4H, m), 1.98-2.16(5H, m), 2.30(6H, s), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.50 (1H, m),
25 3.80(1H, m), 4.16(2H, s), 5.28-5.41(2H, m), 5.93(1H, d, J = 6.9 Hz), 6.78(1H, d,
J=3.9Hz), 7.03-7.14(3H, m), 7.77(1H, d, J = 3.9 Hz). IR (CHCl₃): 3516, 3446,
3427, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} +66.6 \pm 1.0^\circ$ (c=1.009,

MeOH) 元素分析 ($C_{28}H_{36}NO_3S \cdot 0.2H_2O$) 計算値(%): C, 71.67; H, 7.60; N, 2.98; S, 6.83 実測値(%): C, 71.71; H, 7.54; N, 3.15; S, 6.81

化合物番号 1-195

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.05(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.59-
5 1.78(4H, m), 2.01-2.17(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2Hz$), 2.50(1H, m), 3.82(1H, m),
4.32(2H, s), 5.35-5.37(2H, m), 5.94(1H, d, $J=6.9Hz$), 6.76 (1H, d, $J=3.9Hz$),
7.33-7.39(3H, m), 7.50 (1H, m), 7.69(1H, d, $J=3.9Hz$). IR ($CHCl_3$): 3316, 3446,
3427, 1743, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456, 1163, 1126 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+54.5 \pm 1.0^\circ$
($c=1.00$, $CHCl_3$) 元素分析 ($C_{27}H_{30}F_3NO_3S \cdot 0.2H_2O$) 計算値(%): C, 63.93; H,
10 6.02; N, 2.75; S, 6.30 実測値(%): C, 63.92; H, 5.85; N, 2.94; S, 6.38

化合物番号 1-196

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.05(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.58-1.80
(4H, m), 2.01-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2Hz$), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m),
3.88(3H, s), 4.06(2H, s), 5.33-5.38(2H, m), 5.94(1H, d, $J=10.2 Hz$), 6.70(1H, d,
15 $J=3.6Hz$), 6.87-6.97(3H, m), 7.36(1H, d, $J=3.6Hz$). IR ($CHCl_3$): 3517, 3446,
3427, 2673, 1741, 1709, 1643, 1543, 1516, 1274 1030 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+54.2 \pm 0.9^\circ$
($c=1.00$, $CHCl_3$) 元素分析 ($C_{27}H_{32}FNO_4S \cdot 0.3H_2O$) 計算値(%): C, 66.04; H,
6.69; N, 2.85; S, 6.53; F, 3.87 実測値(%): C, 66.16; H, 6.61; N, 2.82; S, 6.34; F,
3.66

20 化合物番号 1-197

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.27(2H, m), 1.41-1.45(2H, m), 1.56-
1.77(4H, m), 1.98-2.13(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5Hz$), 2.50(1H, s), 3.21 (2H, t,
 $J=8.7Hz$), 3.80(1H, m), 4.07(2H, s), 4.57(2H, t, $J=8.7Hz$), 5.29-5.41 (2H, m),
6.00(1H, d, $J=7.5Hz$), 6.79(1H, d, $J=3.6Hz$), 6.79(1H, dd, $J=7.2$ and $7.5Hz$),
25 6.95(1H, d, $J=7.5Hz$), 7.09(1H, d, $J=7.2Hz$), 7.36(1H, d, $J=3.6 Hz$). IR($CHCl_3$):
3514, 3446, 3427, 2669, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1477, 1456, 1441 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{25}+61.1 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($C_{28}H_{33}NO_4S \cdot 0.2H_2O$) 計算値

(%) : C, 69.60; H, 6.97; N, 2.90; S, 6.63 実測値 (%) : C, 69.68; H, 6.89; N, 3.19;
S, 6.65

化合物番号 1-198

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.18-1.27(2H, m), 1.40-1.46(2H, m), 1.56-
5 1.76(4H, m), 1.98-2.13(5H, m), 2.33(2H, t, J=7.5Hz), 2.50(1H, s), 3.21(2H, t,
J=8.7Hz), 3.80(1H, m), 4.24(2H, s), 5.28-5.40(2H, m), 5.97(1H, d, J=7.2Hz),
6.79(1H, d, J=3.6Hz), 7.22(1H, dd, J=1.2 and 8.1Hz), 7.29 (1H, d, J=5.4Hz),
7.38(1H, d, J=3.6Hz), 7.44(1H, d, J=5.4Hz), 7.68(1H, d, J=1.2Hz), 7.81(1H, d,
J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1506, 1547
10 cm⁻¹. [α]_D²⁵+62.0±1.0° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂·0.2H₂O)
計算値 (%) : C, 67.63; H, 6.36; N, 2.82; S, 12.90 実測値 (%) : C, 67.55; H, 6.28;
N, 2.97; S, 12.90

化合物番号 1-199

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.17-1.27(2H, m), 1.40-1.45(2H, m), 1.54-
15 1.77(4H, m), 1.98-2.15(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, s), 3.80 (1H,
m), 4.25(2H, s), 5.28-5.41(2H, m), 5.97(1H, d, J=7.2Hz), 6.79(1H, d, J=3.9Hz),
7.24(1H, dd, J=1.5 and 8.1Hz), 7.30(1H, d, J=5.4Hz), 7.38(1H, d, J=3.6Hz),
7.41(1H, d, J=5.4Hz), 7.73(1H, m), 7.76(1H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3447,
3427, 1741, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458 cm⁻¹. [α]_D²⁵+62.1±1.0° (c=1.008,
20 MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₃S₂·0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 67.39; H, 6.38; N,
2.81; S, 12.85 実測値 (%) : C, 67.42; H, 6.29; N, 2.99; S, 12.94

化合物番号 1-200

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.03(1H, m), 1.16-1.22(2H, m), 1.39-1.44(2H, m), 1.53-1.76
(4H, m), 1.97-2.14(5H, m), 2.33(2H, t, J=7.5Hz), 2.49(1H, s), 3.79 (1H,
25 m), 4.39(2H, s), 5.28-5.40(2H, m), 5.98(1H, d, J=7.5Hz), 6.86(1H, d, J=3.9Hz),
7.21(1H, d, J=6.9Hz), 7.35(1H, dd, J=6.9 and 8.1Hz), 7.36(1H, d, J=5.4Hz),
7.36(1H, d, J=3.9Hz), 7.42(1H, d, J=5.4Hz), 7.74(1H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃):

3516, 3446, 3427, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 58.4 \pm 1.0^\circ$

($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 67.63; H, 6.36; N, 2.82; S, 12.90 実測値 (%): C, 67.62; H, 6.27; N, 3.09; S, 12.92

化合物番号 1-201

5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}) \delta$: 1.08(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.55-1.71(4H, m), 2.01-2.10(5H, m), 2.29(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.51(1H, s), 3.77(1H, m), 4.29(2H, s), 5.34-5.40(2H, m), 6.80(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.93(1H, dd, $J=1.8$ and 8.7Hz), 7.10(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 7.22(1H, s), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.65(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3508, 3423, 3236, 1709, 1633, 1601, 1545, 1510, 1441

10 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 57.5 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.84; H, 6.21; N, 2.70; S, 12.36 実測値 (%): C, 67.57; H, 6.20; N, 2.93; S, 12.38

化合物番号 1-202

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.24-1.28(2H, m), 1.41-1.48(2H, m), 1.58-1.79(4H, m), 2.02-2.22(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.78 (1H, m), 4.25(2H, s), 4.70(2H, s), 5.31-5.42(2H, m), 6.00(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.74(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.24-7.42(5H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3444, 3427, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 51.9 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.04$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{FNO}_4\text{S} \cdot 0.7\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 67.53; H, 7.22; N, 2.92; S, 6.02 実測

20 値 (%): C, 67.92; H, 7.13; N, 2.88; S, 6.11

化合物番号 1-203

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.02(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.40-1.42(2H, m), 1.57-1.72(4H, m), 1.82-1.85(4H, m), 2.01-2.13(5H, m), 2.27(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.49(1H, m), 2.71-2.73(4H, m), 3.67(1H, d, $J=13.2\text{Hz}$), 3.76 (1H, m), 3.83(1H, d, $J=13.2\text{Hz}$), 4.26(1H, d, $J=16.5\text{Hz}$), 4.34(1H, d, $J=16.5\text{Hz}$), 5.33-5.45(2H, m), 6.04(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.70(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.16-7.33 (4H, m), 7.43(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3446, 3424, 2472, 1707, 1643, 1545, 1506, 1456

cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{28} + 41.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.03$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{40}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$)
 計算値 (%) : C, 70.05; H, 7.81; N, 5.27; S, 6.03 実測値 (%) : C, 70.01; H, 7.81;
 N, 5.18; S, 5.86

化合物番号 1-204

- 5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.06(1H, m), 1.22-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.58-1.72(4H, m), 2.03-2.17(5H, m), 2.31(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 2.60 (6H, s), 3.79(1H, m), 3.94(1H, d, $J=13.2\text{Hz}$), 3.99(1H, d, $J=13.2\text{Hz}$), 4.39 (2H, s), 5.30-5.44(2H, m), 6.01(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.72(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.26-7.40(4H, m), 7.56(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3519, 3444, 3425, 2455, 1753, 1712, 1643,
 10 1545, 1508, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26} + 41.2 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.02$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{38}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 1.7\text{H}_2\text{O} \cdot 0.2\text{CHCl}_3$) 計算値 (%) : C, 63.86; H, 7.63; N, 5.10; S, 5.84; Cl, 3.87 実測値 (%) : C, 63.88; H, 7.51; N, 4.94; S, 5.63; Cl, 4.22

化合物番号 1-205

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.14(1H, m), 1.24-1.36(2H, m), 1.45-1.54(2H, m), 1.60-1.79(4H, m), 2.03-2.26(5H, m), 2.36(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.58(1H, m), 3.19-3.26(4H, m), 3.89(1H, m), 5.32-5.45(2H, m), 6.33(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.24(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.34 and 7.46(each 1H, each m), 7.61(1H, dd, $J=1.5$ and 8.4Hz), 7.68(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.98-8.04(2H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3444, 2667, 1709, 1649, 1597, 1514, 1483, 1450, 1294 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{28} + 78.7 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析
 15 ($\text{C}_{30}\text{H}_{33}\text{NO}_4$) 計算値 (%) : C, 75.54; H, 7.10; N, 2.94 実測値 (%) : C, 75.62; H, 7.05; N, 2.94

化合物番号 1-206

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.10(1H, m), 1.22-1.36(2H, m), 1.40-1.52(2H, m), 1.56-1.81(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.50(1H, m), 3.84 (1H, m),
 25 3.99(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.05(1H, d, $J=3.3\text{Hz}$), 6.29(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.99-7.05(3H, m), 7.17-7.22(2H, m). IR(CHCl_3): 3512, 3435, 1739, 1709, 1653, 1606, 1549, 1510 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26} + 71.0 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析

(C₂₆H₃₀FNO₄) 計算値 (%) : C, 71.05; H, 6.88; N, 3.19; F, 4.32 実測値 (%) : C, 70.78; H, 6.97; N, 3.30; F, 4.27

化合物番号 I-207

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.10(1H, m), 1.22-1.34(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.56-
5 1.81(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.50(1H, m), 3.84 (1H, m),
4.02(2H, s), 5.30-5.43(2H, m), 6.07(1H, d, J=3.3Hz), 6.30(1H, d, J=7.5Hz),
7.02(1H, d, J=3.3Hz), 7.22-7.36(5H, m). IR(CHCl₃): 3516, 3435, 2669, 1709,
1651, 1606, 1547, 1498 cm⁻¹. [α]_D²⁴+76.5±1.2° (c=1.005, MeOH) 元素分析
(C₂₆H₃₁FNO₄ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 73.77; H, 7.43; N, 3.31 実測値 (%) : C,
10 73.63; H, 7.27; N, 3.42

化合物番号 I-208

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.16-1.26(2H, m), 1.39-1.44(2H, m), 1.55-
1.76(4H, m), 1.98-2.18(5H, m), 2.33(2H, t, J=7.2Hz), 2.50(1H, s), 3.79 (1H,
m), 4.42(2H, s), 5.28-5.40(2H, m), 5.98(1H, d, J=6.9Hz), 6.78(1H, d, J=2.1Hz),
15 6.84(1H, d, J=3.6Hz), 7.12-7.21(2H, m), 7.36(1H, d, J=3.6Hz), 7.50(1H, dd,
J=1.5 and 7.5Hz), 7.63(1H, d, J=2.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 2665,
1741, 1709, 1643, 1523, 1506, 1458, 1427 cm⁻¹. [α]_D²⁵+63.4±1.0° (c=1.006,
MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₁NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 69.89; H, 6.58; N,
2.91; S, 6.66 実測値 (%) : C, 69.68; H, 6.48; N, 3.10; S, 6.62

20 化合物番号 I-209

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.07(1H, m), 1.22-1.29(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.59-
1.82(4H, m), 2.01-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.2Hz), 2.52(1H, m), 2.94 (3H, s),
3.81(1H, m), 4.19(2H, s), 4.44(2H, s), 5.31-5.38(2H, m), 5.35 (1H, d, J=7.2Hz),
6.63-6.72(4H, m), 7.16-7.25(6H, m), 7.36(1H, d, J=3.6 Hz). IR (CHCl₃): 3514,
25 3444, 3427, 1741, 1709, 1643, 1599, 1543, 1506, 1456 cm⁻¹. [α]_D²⁶+50.8±0.9°
(c=1.04, CHCl₃) 元素分析 (C₃₄H₄₀N₂O₃S · 0.7H₂O) 計算値 (%) : C, 71.72; H,
7.33; N, 4.92; S, 5.63 実測値 (%) : C, 71.81; H, 7.29; N, 4.81; S, 5.54

化合物番号 1-210

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.14-1.68(11H, m), 1.91-2.16(9H, m), 2.21(2H, t, $J=7.2$ Hz),
 2.57(1H, m), 2.98(1H, m), 3.71(1H, m), 3.89(2H, s), 4.28(1H, d, $J=16.5$ Hz),
 4.30(1H, d, $J=16.5$ Hz), 5.28-5.50(3H, m), 6.56(1H, m), 6.75(1H, m), 7.20-7.33
 5 (2H, m), 7.49-7.55(2H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3425, 1753, 1711, 1641, 1545,
 1508, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 35.6 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.03$, CHCl_3)

化合物番号 1-211

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.04(1H, m), 1.17-1.28(2H, m), 1.39-1.46(2H, m), 1.54-
 1.78(4H, m), 1.98-2.19(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m),
 10 4.29(2H, s), 5.28-5.40(2H, m), 5.95(1H, d, $J=7.2$ Hz), 6.82(1H, d, $J=3.6$ Hz),
 7.23(1H, dd, $J=1.5$ and 8.1 Hz), 7.30-7.47(4H, m), 7.55(1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.89(1H,
 d, $J=7.8$ Hz), 7.93(1H, dd, $J=1.5$ and 7.8 Hz). IR (CHCl_3): 3510, 3446, 3427,
 2671, 1739, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458, 1427 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 60.2 \pm 1.0^\circ$
 ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 72.34; H,
 15 6.34; N, 2.64; S, 6.04 実測値 (%): C, 72.28; H, 6.25; N, 2.72; S, 5.93

化合物番号 1-212

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.54-
 1.80(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.51(1H, m), 3.78 (3H, s),
 3.80(1H, m), 3.86(3H, s), 4.15(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.93(1H, d, $J=7.5$ Hz),
 20 6.78-6.85(3H, m), 7.01(1H, t, $J=8.1$ Hz), 7.36(1H, d, $J=3.9$ Hz). IR(CHCl_3): 3516,
 3446, 3425, 2667, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1481, 1273, 1076 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{25} + 60.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値
 (%): C, 67.33; H, 7.10; N, 2.80; S, 6.42 実測値 (%): C, 67.21; H, 7.08; N, 2.92;
 S, 6.45

25 化合物番号 1-213

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.08(1H, m), 1.19-1.30(2H, m), 1.42-1.47(2H, m), 1.58-
 1.78(4H, m), 2.01-2.16(5H, m), 2.38(2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.39(3H, s), 2.53 (1H,

s), 3.82(1H, m), 4.15(2H, s), 5.31-5.44(2H, m), 5.87(1H, s), 6.05(1H, d, J=7.2Hz),
 6.86(1H, d, J=3.9Hz), 7.38(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3444, 3427,
 2669, 1709, 1643, 1608, 1545, 1508, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 64.3 \pm 1.0^\circ$ (c=1.012,
 MeOH) 元素分析 (C₂₄H₃₀N₂O₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 64.61; H, 6.87; N,
 5 6.28; S, 7.19 実測値 (%) : C, 64.70; H, 6.84; N, 6.34; S, 7.27

化合物番号 I-214

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.06(1H, m), 1.19-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.58-
 1.79(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.33-2.37(5H, m), 2.51(1H, s), 3.81-3.82 (4H, m),
 4.08(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.93(1H, d, J=6.9Hz), 6.70(1H, s), 6.72(1H, d,
 10 J=7.8Hz), 6.77(1H, d, J=3.6Hz), 7.04(1H, d, J=7.8Hz), 7.34 (1H, d, J=3.6Hz).
 IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 2669, 1741, 1709, 1641, 1614, 1583, 1506, 1458
 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 58.9 \pm 1.0^\circ$ (c=1.012, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₅NO₄S · 0.2H₂O)
 計算値 (%) : C, 69.31; H, 7.35; N, 2.89; S, 6.61 実測値 (%) : C, 69.21; H, 7.35;
 N, 3.03; S, 6.65

15 化合物番号 I-215

mp.128-129°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05 (1H, m), 1.19-1.28 (2H, m), 1.41-1.46
 (2H, m), 1.56-1.79(4H, m), 2.00-2.15(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, s),
 3.80(1H, m), 3.84(3H, s), 4.33(2H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 5.94(1H, d, J=6.9Hz),
 6.83(1H, d, J=3.6Hz), 7.01(1H, dd, J=2.7 and 9.0Hz), 7.11(1H, d, J=2.7Hz),
 20 7.21(1H, s), 7.36(1H, d, J=3.6Hz), 7.72 (1H, d, J=9.0Hz). IR(CHCl₃): 3516,
 3446, 3427, 1739, 1709, 1643, 1601, 1543, 1506, 1458, 1427 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 55.7$
 $\pm 1.0^\circ$ (c=1.008, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₃NO₄S₂) 計算値 (%) : C, 66.51; H,
 6.35; N, 2.67; S, 12.25 実測値 (%) : C, 66.41; H, 6.30; N, 2.96; S, 12.15

化合物番号 I-216

25 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.04(1H, m), 1.16-1.29(2H, m), 1.39-1.46(2H, m), 1.55-1.79
 (4H, m), 1.98-2.19(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.2Hz), 2.51(1H, m), 3.80 (1H, m), 3.87
 and 4.20(each 2H, each s), 5.28-5.40(2H, m), 5.93(1H, d, J=8.1 Hz), 6.81(1H, d,

$J=3.9\text{Hz}$), 7.24-7.39(5H, m), 7.53(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.71-7.77(2H, m).

IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3427, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{25}+56.7\pm 1.0^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{83}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値

(%) : C, 75.14; H, 6.73; N, 2.66; S, 6.08 実測値 (%) : C, 75.14; H, 6.80; N, 2.74;

5 S, 5.83

化合物番号 I-217

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.19-1.32(2H, m), 1.40-1.48(2H, m), 1.56-1.78

(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.54(1H, m), 3.13-3.24 (4H, m),

3.85(1H, m), 4.13(2H, s), 5.28-5.42(2H, m), 6.17(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.06-7.17(4H,

10 m), 7.22(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.44(1H, dd, $J=1.8$ and 7.8Hz), 7.53(1H, d,

$J=1.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3446, 1739, 1709, 1651, 1570, 1518, 1491, 1456

cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+73.3\pm 1.1^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算

値 (%) : C, 78.13; H, 7.44; N, 3.04 実測値 (%) : C, 78.25; H, 7.76; N, 3.29

化合物番号 I-218

15 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-

1.81(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.80(1H, m),

3.82, 3.85 and 3.87(each 3H, each s), 4.07(2H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 5.94(1H, d,

$J=7.5\text{Hz}$), 6.62(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.85(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$),

7.35(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 3427, 1739, 1709, 1641, 1603,

20 1543, 1495, 1468, 1277, 1259, 1097 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+54.8\pm 1.0^\circ$ ($c=1.013$, MeOH)

元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_6\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 65.56; H, 7.10; N, 2.64; S, 6.04

実測値 (%) : C, 65.54; H, 6.96; N, 2.74; S, 5.98

化合物番号 I-219

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-

25 1.81(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.80 (1H, m),

3.82, 3.85 and 3.87(each 3H, each s), 4.07(2H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 5.94(1H, d,

$J=7.5\text{Hz}$), 6.62(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.85(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$),

7.35(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3514, 3446, 3427, 1739, 1709, 1641, 1603, 1543, 1495, 1468, 1277, 1259, 1097 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{26} +54.8 \pm 1.0^\circ$ (c=1.013, MeOH)
 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₆S · 0.2H₂O) 計算値 (%): C, 65.56; H, 7.10; N, 2.64; S, 6.04
 実測値 (%): C, 65.54; H, 6.96; N, 2.74; S, 5.98

5 化合物番号 l-220

mp.131-133°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.06(1H, m), 1.18-1.31(2H, m), 1.40-1.48 (2H, m), 1.56-1.82(4H, m), 2.00-2.21(5H, m), 2.35(2H, t, J=7.5Hz), 2.52 (1H, m), 3.82(1H, m), 3.83(3H, s), 3.84(6H, s), 4.07(2H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 5.95(1H, d, J=7.5Hz), 6.45(2H, s), 6.79(1H, d, J=3.6Hz), 7.36(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃):
 10 3516, 3446, 3427, 1739, 1709, 1643, 1593, 1543, 1506, 1462, 1421, 1331, 1240, 1130 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} +57.5 \pm 1.0^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₆S) 計算値 (%): C, 66.01; H, 7.07; N, 2.65; S, 6.08 実測値 (%): C, 65.84; H, 6.93; N, 2.71; S, 6.06

化合物番号 l-221

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.05(1H, m), 1.17-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-1.80(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.34(2H, t, J=7.5Hz), 2.51(1H, m), 3.81 (1H, m), 4.08(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.95(2H, s), 5.98(1H, d, J=7.5 Hz), 6.68-6.80(4H, m), 7.35(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3446, 3427, 1741, 1709, 1641, 1543, 1504, 1460, 1252, 1063 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} +62.7 \pm 1.0^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素
 20 分析 (C₂₇H₃₁NO₅S) 計算値 (%): C, 67.34; H, 6.49; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%): C, 67.12; H, 6.37; N, 2.98; S, 6.55

化合物番号 l-222

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 1.08(1H, m), 1.24-1.28(2H, m), 1.41-1.45(2H, m), 1.56-1.78(4H, m), 1.97-2.20(5H, m), 2.14(3H, s), 2.33(2H, t, J=7.2Hz), 2.51 (1H, m),
 25 3.77(1H, m), 4.06(2H, s), 5.28-5.42(2H, m), 6.16(1H, d, J=7.2Hz), 6.74 (1H, d, J=3.6Hz), 6.96(1H, d, J=7.5Hz), 7.24(1H, t, J=8.7Hz), 7.35-7.38 (3H, m), 7.74(1H, br s). IR(KBr): 3309, 1707, 1672, 1614, 1547, 1523, 1489, 1441, 1371,

1319 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 57.7 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.012$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.01; H, 6.99; N, 5.58; S, 6.39 実測値 (%) : C, 66.98; H, 6.72; N, 5.47; S, 6.27

化合物番号 I-223

5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.42-1.46(2H, m), 1.55-1.75(4H, m), 2.02-2.22(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 2.99 (3H, s), 3.81(1H, m), 4.11(2H, s), 5.29-5.45(2H, m), 6.04(1H, d, $J = 7.2\text{Hz}$), 6.78 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.04-7.06(2H, m), 7.16(1H, m), 7.25(1H, br s), 7.29(1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.36 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3512, 3444, 3427, 3371, 1709, 1639, 1608, 10
1545, 1508, 1475, 1458, 1389, 1335, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 55.0 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 60.69; H, 6.49; N, 5.24; S, 12.00 実測値 (%) : C, 60.70; H, 6.44; N, 5.15; S, 11.56

化合物番号 I-224

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.07(1H, m), 1.22-1.28(2H, m), 1.42-1.53(2H, m), 1.57-15
1.74(4H, m), 2.00-2.24(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m), 3.81 (1H, m), 4.33(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.98(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.86, 6.88 and 7.14 (each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.22-7.37(4H, m), 7.53-7.56(2H, m).

化合物番号 I-225

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.17-1.30(2H, m), 1.39-1.48(2H, m), 1.54-20
1.81(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 3.81 (1H, m), 4.08(2H, s), 4.23-4.30(4H, m), 5.29-5.42(2H, m), 5.95(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.71-6.80(4H, m), 7.34(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 3427, 1739, 1709, 1641, 1603, 1543, 1506, 1475, 1456, 1284, 1090 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24.5} + 58.9 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 67.85; H, 6.71; N, 25
2.83; S, 6.47 実測値 (%) : C, 68.01; H, 6.72; N, 2.97; S, 6.50

化合物番号 I-226

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.05(1H, m), 1.18-1.30(2H, m), 1.38-1.47(2H, m), 1.54-1.81

(4H, m), 1.98-2.20(5H, m), 2.31(3H, s), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m),
 3.70(3H, s), 3.80(1H, m), 4.16(2H, s), 5.29-5.42(2H, m), 5.95 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$),
 6.78(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.96-7.11(3H, m), 7.37(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3):
 3514, 3446, 3427, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1473, 1458, 1259, 1011 cm^{-1} .

- 5 $[\alpha]_D^{24}+62.7\pm 1.0^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{36}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C,
 69.82; H, 7.32; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%) : C, 69.55; H, 7.27; N, 3.09; S, 6.55
 化合物番号 I-227

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.07(1H, m), 1.24-1.28(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.56-
 1.79(4H, m), 2.00-2.17(5H, m), 2.16(3H, s), 2.33(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51 (1H, m),
 10 3.79(1H, m), 4.08(2H, s), 5.28-5.42(2H, m), 6.05(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.75 (1H, d,
 $J=3.6\text{Hz}$), 7.16(2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.37(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.43 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$),
 7.53(1H, br s). IR(CHCl_3): 3512, 3437, 1707, 1639, 1543, 1516, 1410 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24.5}+60.7\pm 1.0^\circ$ ($c=1.012$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値
 (%) : C, 67.77; H, 7.00; N, 5.56; S, 6.37 実測値 (%) : C, 66.84; H, 6.91; N, 5.56;

- 15 S, 6.26

化合物番号 I-228

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.06(1H, m), 1.22-1.29(2H, m), 1.41-1.46(2H, m), 1.58-1.76
 (4H, m), 2.01-2.17(5H, m), 2.34(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.51(1H, m), 2.99 (3H, s),
 3.80(1H, m), 4.11(2H, s), 5.29-5.43(2H, m), 6.01(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.78(1H, d,
 20 $J=3.6\text{Hz}$), 6.86(1H, br s), 7.17-7.23(4H, m), 7.36(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3):
 3510, 3444, 3427, 3371, 1709, 1639, 1543, 1510, 1456, 1389, 1338, 1155 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24.5}+56.5\pm 1.0^\circ$ ($c=0.953$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算
 値 (%) : C, 60.90; H, 6.47; N, 5.26; S, 12.04 実測値 (%) : C, 61.06; H, 6.45; N,
 5.29; S, 11.52

- 25 化合物番号 I-229

mp.103-105°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.02 (1H, m), 1.15-1.27 (2H, m), 1.37-
 1.45(2H, m), 1.53-1.77(4H, m), 1.96-2.18(5H, m), 2.33 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.49(1H,

m), 3.79(1H, m), 4.40(2H, s), 5.27-5.39 (2H, m), 5.94(1H, d, $J=7.8$ Hz), 6.89(1H, d, $J=3.9$ Hz), 7.32-7.37(2H, m), 7.43-7.48 (3H, m), 7.84(1H, m), 8.08(1H, d, $J=6.9$ Hz), 8.15(1H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3444, 3427, 2667, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1458, 1444 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24.5}+58.9\pm1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 70.68; H, 6.12; N, 2.58; S, 11.79 実測値 (%) : C, 70.52; H, 6.11; N, 2.67; S, 11.72

化合物番号 1-230

mp.86-87°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.02(1H, m), 1.16-1.28(2H, m), 1.37-1.45 (2H, m), 1.54-1.77(4H, m), 1.97-2.17(5H, m), 2.32(2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.49 (1H, m), 3.78(1H, m), 3.79 and 4.26(each 2H, each s), 5.27-5.39(2H, m), 5.93 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 6.78(1H, d, $J=3.9$ Hz), 7.18(1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.29 (1H, m), 7.34-7.40(3H, m), 7.52(1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.72(1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.78(1H, d, $J=7.2$ Hz). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 3427, 2669, 1709, 1641, 1543, 1506, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24.5}+59.2\pm1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{33}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 75.40; H, 6.71; N, 2.66; S, 6.10 実測値 (%) : C, 75.33; H, 6.73; N, 2.75; S, 6.06

化合物番号 1-231

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.04(1H, m), 1.16-1.30(2H, m), 1.38-1.46(2H, m), 1.54-1.81(4H, m), 1.98-2.16(5H, m), 2.21 and 2.50(each 3H, each s), 2.34 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.51(1H, m), 3.66(3H, s), 3.80(1H, m), 4.13(2H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 5.93(1H, d, $J=6.9$ Hz), 6.78(1H, d, $J=3.6$ Hz), 6.89 and 6.96 (each 1H, each d, each $J=7.5$ Hz), 7.36(1H, d, $J=3.6$ Hz). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3425, 2669, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458, 1263, 1084, 1009 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+61.8\pm1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{87}\text{NO}_4\text{S}\cdot0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.76; H, 7.55; N, 2.81; S, 6.42 実測値 (%) : C, 69.80; H, 7.59; N, 2.97; S, 6.34

化合物番号 1-232

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.02(1H, m), 1.16-1.27(2H, m), 1.37-1.45(2H, m), 1.53-1.77(4H, m), 1.96-2.15(5H, m), 2.33(2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.50(1H, m), 3.79 (1H, m),

4.50(2H, s), 5.27-5.40(2H, m), 5.94(1H, d, J=7.5Hz), 6.88(1H, d, J=3.9Hz),
 7.29-7.38(4H, m), 7.47(1H, m), 7.58(1H, d, J=8.4Hz), 7.86(1H, m), 7.95(1H, d,
 J=7.8Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3444, 3427, 2669, 1739, 1708, 1641, 1543, 1506,
 1475, 1452, 1423 cm⁻¹. [α]_D²⁴+58.5 ± 1.0 ° (c=1.006, MeOH) 元素分析
 5 (C₃₂H₃₃NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 72.34; H, 6.34; N, 2.64; S, 6.04 実測値
 (%) : C, 72.36; H, 6.16; N, 2.72; S, 5.94

化合物番号 I-233

mp.125-126°C; ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.05(1H, m), 1.18-1.28(2H, m), 1.41-1.45
 (2H, m), 1.57-1.78(4H, m), 2.00-2.20 (5H, m), 2.33(2H, t, J=7.4 Hz), 2.51 (1H, s),
 10 3.80(1H, m), 4.05 (2H, s), 5.28-5.42 (2H, m), 5.98(1H, d, J=6.6 Hz), 6.76 (1H, d,
 J=3.6Hz), 6.80 and 7.09(each 2H, each d, J=8.4Hz), 7.37(1H, d, J=3.6Hz).
 IR(KBr): 3354, 3132, 2688, 1703, 1616, 1599, 1549, 1514, 1458, 1250 cm⁻¹.
 [α]_D²⁵+67.7 ± 1.1 ° (c=1.001, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₄S) 計算値 (%) : C,
 68.85; H, 6.89; N, 3.09; S, 7.07 実測値 (%) : C, 69.12; H, 6.95; N, 3.10; S, 7.12

15 化合物番号 II-1

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
 1.50-2.41(14H, m), 4.20(1H, m), 5.35-5.47(2H, m), 6.16(1H, d, J=8.7Hz), 6.33
 and 7.16(each 2H, each t, each J=2.4Hz), 7.30 and 7.56 (each 1H, each d, each
 J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3515, 3446, 3144, 3100, 1708, 1658, 1529, 1504, 1456,
 20 1385, 1167 cm⁻¹. [α]_D^{28.5}+54.1 ± 0.9 ° (c=1.004, MeOH) 元素分析
 (C₂₅H₃₂N₂O₅S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 59.08; H, 6.43; N, 5.51; S, 12.62 実測
 値 (%) : C, 59.12; H, 6.36; N, 5.57; S, 12.59

化合物番号 II-6

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.98(1H, d, J=10.2Hz), 1.14 and 1.24(each 3H, each s),
 25 1.54-2.48(14H, m), 4.30(1H, m), 5.35-5.52(2H, m), 6.26 (1H, d, J=8.7Hz), 6.38
 and 7.13 (each 2H, each t, J=2.1Hz), 7.44 and 7.79 (each 2H, each d, each
 J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3453, 2662, 1739, 1708, 1652, 1609, 1500, 1333 cm⁻¹.

$[\alpha]_D^{22} + 65.2 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($C_{27}H_{34}N_2O_3 \cdot 0.3H_2O$) 計算値 (%) : C, 73.71; H, 7.93; N, 6.37 実測値 (%) : C, 73.85; H, 7.88; N, 6.37

化合物番号 II-7

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.95(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.10 and 1.22 (each 3H, each s),
 5 1.52-2.42(14H, m), 4.25(1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.35(1H, d, $J=8.7Hz$), 7.07-7.15(3H, m), 7.21-7.26(2H, m), 7.73 and 7.77(each 2H, each d, each $J=8.7Hz$).
 IR($CHCl_3$): 3518, 3446, 3365, 3249, 2673, 1709, 1655, 1516, 1348, 1167 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{21.5} + 56.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($C_{29}H_{36}N_2O_5S \cdot 0.6H_2O$) 計算値 (%) : C, 65.05; H, 7.00; N, 5.23; S, 5.99 実測値 (%) : C, 65.07; H, 6.94; N, 5.37;

10 S, 6.03

化合物番号 II-8

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.89(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.05 and 1.19(each 3H, each s),
 1.50-2.44(14H, m), 4.15(1H, m), 5.31-5.50(2H, m), 6.31 (1H, d, $J=8.1Hz$),
 7.00(1H, d, $J=1.8Hz$), 7.42-7.47(2H, m), 7.54 (1H, d, $J=1.8Hz$), 7.56(1H, m),
 15 7.76-7.79(2H, m), 8.29(1H, s). IR ($CHCl_3$): 3509, 3446, 3360, 3108, 1708, 1639, 1515, 1448, 1330, 1164 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20} + 39.0 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($C_{27}H_{34}N_2O_5S_2 \cdot 0.2H_2O$) 計算値 (%) : C, 60.09; H, 6.54; N, 5.19; S, 11.88 実測値 (%) : C, 60.07; H, 6.48; N, 5.31; S, 11.92

化合物番号 II-9

20 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.73(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.06 and 1.16(each 3H, each s), 1.43-2.36(14H, m), 4.07(1H, m), 5.28-5.49(2H, m), 6.37 (1H, d, $J=8.7Hz$), 7.28 and 7.33(each 1H, each d, each $J=1.8Hz$), 7.38-7.43 (2H, m), 7.50(1H, m), 7.96-7.99(2H, m). IR($CHCl_3$): 3440, 3254, 3096, 3062, 1708, 1643, 1560, 1530, 1298 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20} + 49.0 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($C_{28}H_{34}N_2O_4S \cdot 0.4H_2O$) 計算値 (%) : C, 67.01; H, 6.99; N, 5.58; S, 6.39 実測値 (%) : C, 66.96; H, 7.04; N, 5.67; S, 6.32

化合物番号 II-10

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.96(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.52-2.44(14H, m), 4.26(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.26(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.31 and 7.15(each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 7.81 and 7.89 (each 2H, each d, each $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 3144, 1708, 1663, 1514, 1377, 1173 cm^{-1} .

- 5 $[\alpha]_D^{22} + 64.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.57; H, 6.90; N, 5.58; S, 6.38 実測値 (%): C, 64.50; H, 6.97; N, 5.71; S, 6.28

化合物番号 II-11

- 10 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.43(14H, m), 4.12(2H, s), 4.22(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.06(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.04(1H, d, $J=1.2\text{Hz}$), 7.22-7.34(2H, m), 7.63 (1H, d, $J=1.2\text{Hz}$).

IR(CHCl_3): 3517, 3451, 3087, 3065, 2670, 1708, 1708, 1647, 1549, 1508 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{21.5} + 41.9 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.015$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 72.22; H, 7.58; N, 3.01; S, 6.89 実測値 (%): C, 72.07; H, 7.57; N, 3.21; S, 6.77

- 15 化合物番号 II-12

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.44 (14H, m), 4.24(1H, m), 5.32-5.48(2H, m), 6.24(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.17 and 7.60(each 2H, each d, each $J=8.7\text{Hz}$), 7.41-7.46 (2H, m), 7.54(1H, m), 7.80-7.84(2H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3451, 3371, 3139, 1709, 1647, 1609, 1496, 1163 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22.5} + 47.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 65.49; H, 6.97; N, 5.27; S, 6.03 実測値 (%): C, 65.51; H, 6.87; N, 5.39; S, 5.89

化合物番号 II-14

- 25 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 4.17(1H, m), 5.35-5.55(2H, m), 6.35 and 7.17 (each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 6.38(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 8.09 and 8.17 (each 1H, each d, each $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3409, 3144, 3107, 1727, 1709, 1657, 1538, 1503,

1456, 1387, 1166 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26.5} + 46.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析
 $(\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O})$ 計算値 (%) : C, 59.08; H, 6.43; N, 5.51; S, 12.62 実測
 値 (%) : C, 59.10; H, 6.45; N, 5.69; S, 12.58

化合物番号 II-15

- 5 mp.119-121°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.97(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.11 and 1.24(each
 3H, each s), 1.53-2.49(14H, m), 4.29(1H, m), 5.39-5.57 (2H, m), 6.37 and
 7.22(each 2H, each t, each $J=2.1\text{Hz}$), 7.13 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.50 and 7.93(each
 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3365, 3145, 3100, 1739, 1621, 1548,
 1405, 1367, 1187 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26.5} + 45.5 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.012$, MeOH) 元素分析
 10 $(\text{C}_{25}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2)$ 計算値 (%) : C, 59.74; H, 6.02; N, 5.57; S, 12.76 実測値 (%) :
 C, 59.56; H, 6.33; N, 5.64; S, 12.76

化合物番号 II-17

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.96 (1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.11 and 1.23(each 3H, each s),
 1.54-2.49(14H, m), 4.25(1H, m), 5.35-5.56(2H, m), 6.33 (2H, t, $J=2.4\text{Hz}$),
 15 6.56(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.17(2H, t, $J=2.4\text{Hz}$), 7.58(1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.93(1H, m),
 8.04(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.24(1H, m). IR (CHCl_3): 3513, 3389, 3144, 2669, 1726,
 1709, 1659, 1515, 1470, 1455, 1375 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 54.0 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.008$, MeOH)
 元素分析 $(\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O})$ 計算値 (%) : C, 64.46; H, 6.90; N, 5.53; S, 6.38
 実測値 (%) : C, 64.45; H, 6.89; N, 5.75; S, 6.42

- 20 化合物番号 II-18

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.96(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s),
 1.52-2.42(14H, m), 2.29(3H, t), 4.26(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 5.96(1H, brs),
 6.19(1H, t, $J=3.2\text{Hz}$), 6.26(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.25 (1H, m), 7.81(4H, s).
 IR(CHCl_3): 3511, 3446, 3152, 1708, 1662, 1514, 1485, 1368, 1164 cm^{-1} .
 25 $[\alpha]_D^{27} + 59.4 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 $(\text{C}_{28}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S})$ 計算値 (%) : C,
 65.60; H, 7.08; N, 5.46; S, 6.25 実測値 (%) : C, 65.41; H, 7.00; N, 5.67; S, 6.24

化合物番号 II-19

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.97(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.03 and 1.22(each 3H, each s),
 1.452-2.46 (14H, m), 4.26(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.20 (2H, t, $J=2.1\text{Hz}$),
 6.22(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.68(2H, t, $J=2.1\text{Hz}$), 7.15 and 7.67 (each 2H, each d,
 each $J=8.1\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3511, 3452, 3103, 2666, 1709, 1652, 1523, 1496
 5 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23}+57.7\pm 1.0^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_3 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計
 算値 (%) : C, 74.67; H, 8.10; N, 6.22 実測値 (%) : C, 74.69; H, 8.21; N, 6.38
 化合物番号 II-20

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.06 and 1.20(each 3H, each s),
 1.49-2.40(14H, m), 4.21(1H, m), 5.31-5.45(2H, m), 6.19(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$),
 10 6.88(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.22-7.35(2H, m), 7.52-7.55(2H, m), 7.74 and 7.91(each
 2H, each d, each $J=8.4\text{Hz}$), 7.98(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3481, 3440,
 3145, 3116, 2661, 1709, 1660, 1516, 1485, 1446, 1377, 1261, 1178, 1130 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{26}+56.6\pm 1.0^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値
 (%) : C, 67.64; H, 6.63; N, 5.09; S, 5.82 実測値 (%) : C, 67.68; H, 6.72; N, 5.35;
 15 S, 5.73

化合物番号 II-21

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22 (each 3H, each s),
 1.52-2.45(14H, m), 4.24(1H, m), 4.63(2H, s), 5.34-5.50(2H, m), 6.25-6.27(2H, m),
 6.40(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.25(1H, dd, $J=1.8$ and 3.0Hz), 7.80 and 7.85(each 2H,
 20 each d, each $J=8.7\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3581, 3518, 3445, 3149, 2666, 1709, 1661,
 1515, 1472, 1371, 1182, 1150 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{27}+58.1\pm 1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素
 分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}$) 計算値 (%) : C, 63.61; H, 6.86; N, 5.30; S, 6.07 実測値 (%) :
 C, 63.50; H, 6.84; N, 5.44; S, 5.89

化合物番号 II-31

25 mp.98-100°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H,
 each s), 1.50-2.43(14H, m), 4.13(2H, s), 4.20 (1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 5.97(1H,
 d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.77(1H, m), 7.21-7.35(6H, m). IR(KBr): 3407, 2674, 1703, 1630,

1511 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24} + 46.8 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}$) 計算值 (%) : C, 72.22; H, 7.58; N, 3.01; S, 6.89 実測値 (%) : C, 72.04; H, 7.36; N, 3.27; S, 6.91

化合物番号 II-37

- 5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.41(14H, m), 4.20(1H, m), 5.39-5.47(2H, m), 6.19(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.35(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.51-7.64(4H, m), 7.98(2H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 2667, 1709, 1657, 1529, 1504, 1327, 1157 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{20} + 55.6^\circ \pm 1.0^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算值 (%) : C, 62.45; H, 6.48; N, 2.70; S, 12.35 実測値 (%) : C, 62.46; H, 6.40; N, 2.75; S, 12.19

化合物番号 II-47

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.41(14H, m), 4.21(1H, m), 5.34-5.48(2H, m), 6.21(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.36 and 7.63(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 7.70(1H, dd, $J=1.5$ and 5.1Hz), 7.75(1H, dd, $J=1.5$ and 3.9Hz). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3097, 1708, 1656, 1529, 1504, 1337, 1153 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 54.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_3$) 計算值 (%) : C, 57.56; H, 5.99; N, 2.68; S, 18.44 実測値 (%) : C, 57.33; H, 5.95; N, 2.68; S, 18.38

化合物番号 II-55

- 20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.41(14H, m), 2.39(3H, d, $J=0.6\text{Hz}$), 4.21(1H, m), 5.35-5.48(2H, m), 5.99(1H, m), 6.15(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.20(1H, t, $J=3.3\text{Hz}$), 7.18(1H, dd, $J=1.8$ and 3.3Hz), 7.31 and 7.54(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3511, 3446, 3150, 3101, 1708, 1658, 1529, 1504, 1375, 1183, 1160 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} + 50.3 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算值 (%) : C, 59.79; H, 6.64; N, 5.36; S, 12.28 実測値 (%) : C, 59.72; H, 6.61; N, 5.51; S, 12.37

化合物番号 II-59

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.07 and 1.21(each 3H, each s),
 1.49-2.41(14H, m), 4.19(1H, m), 5.33-5.47(2H, m), 5.99(1H, d, J=8.7Hz),
 7.01(1H, dd, J=3.6 and 5.4Hz), 7.04 and 7.28(each 1H, each d, each J=3.6Hz),
 7.29(1H, dd, J=1.2 and 3.6Hz), 7.43(1H, dd, J=1.2 and 5.4Hz). IR(CHCl₃):
 5 3518, 3449, 3430, 2672, 1708, 1646, 1530, 1500, 1421 cm⁻¹. [α]_D^{25.5}+45.9±
 0.9° (c=1.010, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₁NO₃S₃) 計算値 (%): C, 61.32; H, 6.38;
 N, 2.86; S, 19.64 実測値 (%): C, 61.17; H, 6.42; N, 3.00; S, 19.80

化合物番号 II-60

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 0.96 (1H, d, J=10.2 Hz), 1.10 and 1.22 (each 3H, each s),
 10 1.51-1.79 (3H, m), 1.83-2.44 (11H, m), 4.26 (1H, m), 5.33-5.49 (2H, m), 6.21
 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.25 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.34-7.47 (5H, m), 7.60 (2H, d, J=9.0
 Hz) IR (CHCl₃): 3453, 3062, 3029, 3014, 2925, 2870, 1739, 1708, 1651, 1595,
 1583, 1557, 1515, 1481 cm⁻¹. [α]_D²²+61.0° (c=1.01, CH₃OH) 元素分析
 (C₂₉H₃₅NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 72.65; H, 7.48; N, 2.92; S, 6.69 実測値
 15 (%): C, 72.50; H, 7.45; N, 3.19; S, 6.69

化合物番号 II-81

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.07 and 1.21(each 3H, each s),
 1.49-2.41(14H, m), 2.46(3H, d, J=1.2Hz), 4.18(1H, m), 5.33-5.47(2H, m),
 5.99(1H, d, J=8.4Hz), 6.66(1H, m), 6.99(1H, d, J=3.9 Hz), 7.10(1H, d, J=3.3Hz),
 20 7.26(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3509, 3449, 2671, 1708, 1645, 1530, 1500,
 1420 cm⁻¹. [α]_D^{25.5}+43.5±0.8° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₃NO₃S₃) 計
 算値 (%): C, 61.99; H, 6.60; N, 2.78; S, 19.10 実測値 (%): C, 61.77; H, 6.68;
 N, 2.83; S, 18.91

化合物番号 II-82

25 mp.118-120°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.09 and 1.22(each
 3H, each s), 1.51-2.42(14H, m), 2.53(3H, d, J=0.9Hz), 4.20 (1H, m), 5.35-
 5.48(2H, m), 6.17(1H, d, J=8.7Hz), 6.77(1H, m), 7.34 (1H, d, J=3.9Hz), 7.57(1H,

d, J=3.6Hz), 7.60(1H, d, J=3.9Hz). IR (Nujol): 3399, 3082, 1733, 1613, 1543, 1328, 1318, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25.5} +54.0 \pm 0.9^\circ$ (c=1.012, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_3$) 計算値 (%) : C, 58.29; H, 6.21; N, 2.61; S, 17.95 実測値 (%) : C, 58.08; H, 6.18; N, 2.73; S, 17.66

5 化合物番号 II-88

mp.91-92°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, J=10.5Hz), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 4.16(2H, s), 4.20 (1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 5.99(1H, d, J=8.7Hz), 6.79(1H, d, J = 3.9 Hz), 6.96 (1H, dd, J=1.2 and 4.8Hz), 7.05(1H, m), 7.28(1H, dd, J=3.0 and 4.8Hz), 7.32(1H, d, J=3.9Hz). IR(Nujol): 3408, 2677, 1703, 1626, 1541, 1514, 1246 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} +43.8 \pm 0.8^\circ$ (c=1.005, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 66.21; H, 7.05; N, 2.97; S, 13.60 実測値 (%) : C, 66.00; H, 7.81; N, 3.11; S, 13.69

化合物番号 II-92

mp.165-166°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.20(each 3H, each s), 1.50-2.45(14H, m), 4.17(1H, m), 5.33-5.51(2H, m), 6.04(1H, d, J=8.4Hz), 6.51(1H, dd, J=1.5 and 3.3Hz), 7.15(1H, dd, J=2.4 and 3.3Hz), 7.52-7.57(2H, m), 7.65(1H, m), 7.74(1H, dd, J=1.8 and 2.1Hz), 7.89-7.93(1H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3449, 3144, 1733, 1708, 1650, 1570, 1507, 1384, 1185, 1176 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} +33.8 \pm 0.7^\circ$ (c=1.011, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 65.04; H, 6.87; N, 5.62; S, 6.43 実測値 (%) : C, 64.95; H, 6.68; N, 5.69; S, 6.40

化合物番号 II-93

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.46(14H, m), 4.19(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.03(1H, d, J=8.7Hz), 6.52(1H, dd, J=1.5 and 3.3Hz), 7.11(1H, dd, J=3.9 and 4.8Hz), 7.17(1H, dd, J=2.1 and 3.3Hz), 7.70-7.72(2H, m), 7.74(1H, dd, J=1.2 and 3.9Hz). IR(CHCl_3): 3510, 3448, 3143, 2666, 1733, 1708, 1650, 1572, 1507, 1387, 1179

cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 39.1^\circ \pm 0.8^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₂N₂O₅S₂) 計算値 (%) : C, 59.50; H, 6.39; N, 5.55; S, 12.71 実測値 (%) : C, 59.49; H, 6.46; N, 5.47; S, 12.70

化合物番号 II-94

5 mp.132-133°C 300MHz ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.54-2.44(14H, m), 4.19(1H, m), 5.33-5.50 (2H, m), 6.03(1H, d, J=8.7Hz), 6.52(1H, dd, J=1.5 and 3.3Hz), 7.11(1H, dd, J=3.9 and 4.8Hz), 7.17(1H, dd, J=2.1 and 3.3Hz), 7.70-7.72(2H, m), 7.74(1H, dd, J=1.5 and 3.9Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3448, 3143, 3099, 1733, 1708, 1650, 1572, 1507, 10
1473, 1387, 1179 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 39.1 \pm 0.8^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₂N₂O₅S₂) 計算値 (%) : C, 59.50; H, 6.39; N, 5.55; S, 12.71 実測値 (%) : C, 59.49; H, 6.46; N, 5.47; S, 12.70

化合物番号 II-98

mp.138-139°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.13 and 1.24(each 3H, each s), 1.50-2.47(14H, m), 4.24(1H, m), 5.36-5.52 (2H, m), 6.06(1H, d, J=8.4Hz), 6.98(1H, d, J=3.9Hz), 6.99 and 7.05 (each 1H, each d, each J=16.2Hz), 7.28-7.34(3H, m), 7.37 (1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3449, 3431, 2665, 1708, 1642, 1538, 1519, 1500 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 49.1 \pm 0.9^\circ$ (c=1.014, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₃S₂) 計算値 (%) : C, 67.05; H, 6.88; N, 2.90; S, 13.26 実測値 (%) :
20 C, 67.94; H, 6.86; N, 2.99; S, 13.23

化合物番号 II-99

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=9.9Hz), 1.07 and 1.22 (each 3H, each s), 1.50-2.44(14H, m), 4.20(1H, m), 5.30-5.51(2H, m), 5.97(1H, d, J=9.0Hz), 6.58(2H, s), 6.95(1H, d, J=3.9Hz), 7.02(1H, dd, J=1.5 and 4.8Hz), 7.25-7.31(2H, 25 m), 7.31(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3517, 3449, 3430, 2664, 1708, 1642, 1536, 1519, 1501 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 38.6 \pm 0.8^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₇H₃₃NO₃S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 66.55; H, 6.91; N, 2.87; S, 13.16 実測

値 (%) : C, 66.52; H, 6.81; N, 3.11; S, 12.93

化合物番号 II-100

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
 1.50-2.39(14H, m), 2.44(3H, d, $J=0.9\text{Hz}$), 4.20(1H, m), 5.34-5.49(2H, m),
 5 5.98(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.70(1H, m), 7.06(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.10(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$),
 7.30(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3450; 3430, 3110, 2669, 1740, 1708,
 1645, 1530, 1499, 1420 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+46.0\pm0.9^\circ$ ($c=0.968$, MeOH) 元素分析
 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_3$) 計算値 (%) : C, 61.99; H, 6.60; N, 2.78; S, 19.10 実測値 (%) : C,
 61.99; H, 6.61; N, 2.87; S, 19.18

10 化合物番号 II-101

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
 1.51-2.42(14H, m), 2.47(3H, d, $J=0.9\text{Hz}$), 4.21(1H, m), 5.35-5.49(2H, m),
 6.18(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.04(1H, m), 7.36 and 7.60(each 1H, each d, each
 $J=3.9\text{Hz}$), 7.91(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3447, 3115, 2670, 1708,
 15 1656, 1529, 1504, 1443, 1329, 1156, 1143 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+53.8\pm0.9^\circ$ ($c=1.008$,
 MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_5\text{S}_3$) 計算値 (%) : C, 58.29; H, 6.21; N, 2.61; S,
 17.96 実測値 (%) : C, 58.07; H, 6.05; N, 2.69; S, 17.94

化合物番号 II-102

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
 20 1.50-2.45(14H, m), 4.22(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 6.04(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.52
 and 6.69(each 1H, each d, each $J=12.0\text{Hz}$), 6.99 (1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz),
 7.07(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.13(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.27(1H, dd, $J=0.9$ and 5.1Hz),
 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3510, 3449, 3430, 2664, 1708, 1643, 1536,
 1501 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+40.3\pm0.8^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot$
 25 $0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.31; H, 6.92; N, 2.86; S, 13.11 実測値 (%) : C, 66.29;
 H, 6.81; N, 3.07; S, 13.13

化合物番号 II-103

mp.117-118°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.97(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.13 and 1.24(each 3H, each s), 1.50-2.47(14H, m), 4.24(1H, m), 5.36-5.52(2H, m), 6.06(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.97 and 7.15(each 1H, each d, each $J=15.9\text{ Hz}$), 6.98(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.01(1H, dd, $J=3.3$ and 4.8Hz), 7.09 (1H, d, $J=3.3\text{Hz}$), 7.23(1H, d, $J=4.8\text{Hz}$),
 5 7.36(1H, d, $J=3.9\text{ Hz}$). IR(CHCl_3): 3517, 3450, 2670, 1738, 1708, 1641, 1537, 1518, 1500 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+55.7 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 67.05; H, 6.88; N, 2.90; S, 13.26 実測値 (%) : C, 66.91; H, 6.83; N, 2.97; S, 13.13

化合物番号 II-107

10 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 4.20(1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.22 and 6.23(total 1H, each d, $J=8.1$ and 8.7Hz), 7.12(1H, dd, $J=3.9$ and 5.1 Hz), 7.44(2H, m), 7.60(1H, m), 7.69(1H, m). IR(CHCl_3): 3509, 3447, 3092, 1708, 1653, 1530, 1503 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+49.3 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S}_3 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値
 15 (%) : C, 58.54; H, 6.25; N, 2.73; S, 18.75 実測値 (%) : C, 58.62; H, 6.16; N, 2.88; S, 18.72

化合物番号 II-108

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.10(total 3H, each s), 1.22 and 1.23(total 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 2.52 and 2.53(total 3H, each d, $J=0.6\text{Hz}$), 4.20(1H, m), 5.35-5.50(2H, m), 6.23 and 6.24(total 1H, each d, $J=8.7$ and 8.4Hz), 6.77(1H, m), 7.39-7.46 (3H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3447, 3429, 3093, 2665, 1708, 1652, 1530, 1502, 1437 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+47.4 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.47; H, 6.45; N, 2.67; S, 18.32 実測値 (%) : C, 59.59; H, 6.16; N, 2.76; S, 18.11

25 化合物番号 II-112

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.51-2.43(14H, m), 3.38(3H, s), 4.18(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 5.83(1H, d,

$J=8.7\text{Hz}$), 6.16(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.14(1H, m), 7.21-7.27 (4H, m), 7.33-7.39(2H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3450, 2661, 1739, 1709, 1628, 1597, 1495, 1479, 1415, 1132 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23.5}+50.8^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{36}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.45; H, 7.58; N, 5.78; S, 6.62 実測値 (%) : C, 69.45;

5 H, 7.39; N, 5.99; S, 6.65

化合物番号 II-113

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.44(14H, m), 2.31(3H, s), 4.22(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 6.01(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.03-7.21(4H, m), 7.38(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3448, 10
3429, 1739, 1709, 1647, 1529, 1500, 1473, 1421 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20}+46.2^\circ \pm 1.0^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.08; H, 7.12; N, 2.79; S, 12.79 実測値 (%) : C, 67.12; H, 7.04; N, 2.94; S, 12.88

化合物番号 II-114

mp.112-115°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.39(14H, m), 2.42(3H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.47(2H, m), 6.17(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.34(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.41 (2H, m), 7.59(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.78(2H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 1739, 1707, 1655, 1529, 1504, 1331, 1151
15 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20}+53.0^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 63.06; H, 6.69; N, 2.63; S, 12.02 実測値 (%) : C, 63.07; H, 6.62; 20 N, 2.73; S, 12.04

化合物番号 II-115

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.44(14H, m), 3.77(3H, s), 4.22(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 6.04(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.74-6.89(3H, m), 7.17-7.23(2H, m), 7.40 (1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). 25 IR(CHCl_3): 3514, 3448, 3431, 1739, 1707, 1649, 1529, 1500, 1477 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20}+45.8^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 64.78; H, 6.91; N, 2.70; S, 12.35 実測値 (%) : C, 64.62; H, 6.83; N,

2.85; S, 12.65

化合物番号 II-116

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
 1.50-2.41(14H, m), 3.86(3H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.47 (2H, m), 6.17(1H, d,
 5 $J=8.7\text{Hz}$), 7.12(1H, m), 7.35(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.40-7.48(2H, m), 7.56(1H, m),
 7.60(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 2667, 1707, 1657, 1599, 1529,
 1504, 1481, 1329, 1252, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20} +52.6^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元
 素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_6\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%): C, 61.22; H, 6.50; N, 2.55; S, 11.67
 実測値(%): C, 61.10; H, 6.36; N, 2.65; S, 11.73

10 化合物番号 II-117

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.92(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.20(each 3H, each s),
 1.52-2.43(14H, m), 4.18(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.42(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$),
 7.07(1H, m), 7.33-7.39(2H, m), 7.46-7.51(2H, m), 7.56 (1H, d,
 $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3587, 3442, 3280, 1707, 1643, 1531, 1329, 1308, 1149
 15 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{20} +53.2^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_6\text{S}_2 \cdot$
 $0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%): C, 60.18; H, 6.32; N, 2.60; S, 11.90 実測値(%): C, 60.19;
 H, 6.06; N, 2.63; S, 11.99

化合物番号 II-118

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.91(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
 20 1.50-2.45(14H, m), 4.20(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.17(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$),
 6.72(2H, m), 6.79(1H, m), 7.11(2H, m), 7.38(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3342,
 2669, 1707, 1622, 1583, 1535 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{23} +45.6^\circ \pm 0.9^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元
 素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%): C, 64.44; H, 6.69; N, 2.78; S, 12.74
 実測値(%): C, 64.33; H, 6.59; N, 2.83; S, 13.07

25 化合物番号 II-119

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
 1.50-2.43(14H, m), 3.79(3H, s), 4.10(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m),

5.98(1H, d, J=8.7Hz), 6.76-6.85(4H, m), 7.24(1H, m), 7.32(1H, d, J=3.9Hz).

IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2669, 1738, 1709, 1641, 1600, 1437, 1261 cm⁻¹.

[α]_D^{23.5}+42.8° ±0.8° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₄S) 計算値(%): C, 70.27; H, 7.52; N, 2.83; S, 6.47 実測値 (%) : C, 70.05; H, 7.55; N, 2.84; S, 6.45

5 化合物番号 II-125

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=9.9Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 2.28(3H, s), 4.12(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.48 (2H, m), 5.98(1H, d, J=9.0Hz), 6.71(1H, d, J=3.6Hz), 7.17 (4H, s), 7.30(1H, d, J=3.6Hz).

IR(CHCl₃): 3518, 3450, 3430, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1471, 1458 cm⁻¹.

10 [α]_D^{22.5}+42.9° ±0.8° (c=1.000, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₃S) 計算値(%): C, 72.61; H, 7.77; N, 2.92; S, 6.68 実測値 (%) : C, 72.43; H, 7.78; N, 3.09; S, 6.62

化合物番号 II-126

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.5Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 3.84(3H, s), 4.12(2H, s), 4.19(1H, m), 5.33-5.48 (2H, m),

15 5.98(1H, d, J=9.0Hz), 6.77(1H, dt, J=0.9 and 3.9 Hz), 6.88(1H, d, J=8.1Hz), 9.90(1H, m), 7.15(1H, m), 7.23(1H, m), 7.28(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3509, 3450, 3431, 2664, 1739, 1708, 1639, 1544, 1506, 1464 cm⁻¹. [α]_D²⁴+40.4° ±0.8° (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₄S · 0.1H₂O) 計算値(%): C, 70.02; H, 7.53; N, 2.81; S, 6.45 実測値 (%) : C, 69.92; H, 7.53; N, 2.96; S, 6.46

20 化合物番号 II-127

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=10.5Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.18(3H, t, J=7.8Hz), 1.50-2.42(14H, m), 2.64(2H, q, J = 7.8 Hz), 4.15(2H, s), 4.19(1H, m), 5.33-5.48(2H, m), 5.96(1H, d, J = 9.3 Hz), 6.68 (1H, d, J=3.6Hz), 7.16-7.25(4H, m), 7.29(1H, d, J = 3.6 Hz). IR (CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2667,

25 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1471, 1456 cm⁻¹. [α]_D²¹+41.9±0.8° (c=1.013, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₉NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 72.72; H, 7.97; N, 2.83; S, 6.47 実測値 (%) : C, 72.55; H, 7.88; N, 3.19; S, 6.62

化合物番号 II-129

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 2.43(3H, s), 4.20(1H, m), 4.24(2H, s), 5.34-5.49 (2H, m), 5.99(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.58(1H, m), 6.67(1H, d, $J=3.3\text{Hz}$), 6.83(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 2667, 1709, 1643, 1545, 1508, 1471, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22} + 42.8 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値(%): C, 66.77; H, 7.26; N, 2.88; S, 13.20 実測値(%): C, 66.60; H, 7.23; N, 2.93; S, 13.19

化合物番号 II-132

10 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.50-2.44(14H, m), 2.31(3H, s), 4.21(1H, m), 4.25(2H, s), 5.34-5.49 (2H, m), 6.01(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.83(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.03 (1H, m), 7.11-7.20(3H, m), 7.27(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 2665, 1739, 1709, 1643, 1543, 1508, 1473 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22} + 42.6 \pm 1.0^\circ$ ($c=0.861$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S}_2\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%): C, 67.59; H, 7.31; N, 2.72; S, 12.44 実測値(%): C, 67.49; H, 7.27; N, 2.82; S, 12.35

化合物番号 II-133

20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.44(14H, m), 4.15(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.01(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.13(1H, dd, $J=0.6$ and 3.0Hz), 6.32(1H, dd, $J=1.8$ and 3.0Hz), 6.84 and 7.22(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.47(1H, dd, $J=0.6$ and 1.8Hz). IR(CHCl_3): 3518, 3450, 3431, 2669, 1739, 1709, 1643, 1545, 1506 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} + 45.8 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{38}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値(%): C, 66.95; H, 7.39; N, 3.00; S, 6.87 実測値(%): C, 67.04; H, 7.17; N, 3.11; 25 S, 7.03

化合物番号 II-134

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.10 and 1.22(each 3H, each s),

1.52-2.45(14H, m), 3.96(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.00(1H, d, J=8.7Hz), 6.30(1H, dd, J=0.9 and 1.8Hz), 6.81(1H, d, J=3.6Hz), 7.31-7.33(2H, m), 7.38(1H, t, J=1.8Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2663, 1739, 1709, 1643, 1545, 1506 cm⁻¹. [α]_D²¹+46.5 ± 0.9 ° (c=1.002, MeOH) 元素分析
 5 (C₂₆H₃₃NO₄S · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 68.27; H, 7.32; N, 3.06; S, 7.01 実測値 (%): C, 68.08; H, 7.14; N, 3.21; S, 7.19

化合物番号 II-135

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.41(2H, s), 5.33-5.49(2H, m), 6.01(1H, d, J=8.7Hz), 6.91(1H, d, J=3.6Hz), 7.11(1H, s), 7.27-7.35(3H, m), 7.68-7.77(2H, m). IR(CHCl₃): 3512, 3446, 3431, 1709, 1645, 1543, 1508 cm⁻¹. [α]_D²⁴+44.9 ± 0.9° (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%): C, 68.35; H, 6.81; N, 2.66; S, 12.17 実測値 (%): C, 68.17; H, 6.52; N, 2.68; S, 12.04

化合物番号 II-136

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.94(1H, d, J=10.5Hz), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.41(14H, m), 4.19(1H, m), 4.29(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 6.02(1H, d, J=8.4Hz), 6.51(1H, s), 6.91(1H, d, J=3.6Hz), 7.16-7.25 (2H, m), 7.34(1H, d, J=3.6Hz), 7.42(1H, d, J=8.4Hz), 7.50(1H, m). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1643, 1545, 1508, 1454 cm⁻¹. [α]_D²³+42.3 ± 0.8° (c=1.001, MeOH)
 20 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₄S · 0.3H₂O) 計算値 (%): C, 70.50; H, 7.02; N, 2.74; S, 6.27 実測値 (%): C, 70.36; H, 6.94; N, 2.70; S, 6.17

化合物番号 II-138

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.20(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.19(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, J=9.0Hz), 6.80(1H, d, J=3.6Hz), 7.22 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.31-7.50(7H, m), 7.57(2H, m). IR(CHCl₃): 3518, 3450, 3431, 2671, 1739, 1709, 1643, 1543, 1506, 1471, 1456 cm⁻¹. [α]_D²⁴+38.7 ± 0.8° (c=1.014, MeOH) 元素分析 (C₃₄H₃₉NO₃S ·

0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 74.88; H, 7.28; N, 2.57; S, 5.88 実測値 (%) : C, 74.92;
H, 7.30; N, 2.75; S, 5.99

化合物番号 II-139

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.06 and 1.22(each 3H, each
5 s), 1.52-2.48(14H, m), 4.11(2H, s), 4.31(1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.15(1H, d,
J=9.0Hz), 7.19-7.30(6H, m), 7.76(1H, d, J=8.1Hz), 7.83(1H, s), 8.15(1H, s)
IR(CHCl₃): 3516, 3442, 2667, 1739, 1709, 1651, 1514, 1495, 1471, 1454, 1435
cm⁻¹. [α]_D²⁴+42.8±0.8° (c=1.011, MeOH) 元素分析 (C₃₂H₃₇NO₃S) 計算値
(%) : C, 74.53; H, 7.23; N, 2.72; S, 6.22 実測値 (%) : C, 74.25; H, 7.20; N, 2.97;
10 S, 6.05

化合物番号 II-140

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.98(1H, d, J=10.2Hz), 1.10 and 1.23(each 3H, each
s), 1.52-2.49(14H, m), 4.10(2H, s), 4.32(1H, m), 5.35-5.53(2H, m), 6.17(1H, d,
J=8.7Hz), 7.19-7.32(6H, m), 7.64(1H, d, J=0.9Hz), 7.76(1H, s), 8.21(1H, d,
15 J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3442, 2671, 1739, 1707, 1651, 1514, 1493, 1469,
1454, 1404 cm⁻¹. [α]_D²⁴+47.1 ± 0.9 ° (c=1.001, MeOH) 元素分析
(C₃₂H₃₇NO₃S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 74.01; H, 7.26; N, 2.70; S, 6.17 実測値
(%) : C, 73.89; H, 7.44; N, 2.93; S, 6.04

化合物番号 II-141

20 mp.134-135°C 300MHz ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.5Hz), 0.98 and
1.15(each 3H, each s), 1.48-2.43(14H, m), 4.20(1H, m), 4.40 and 4.54(each 1H,
each d, J=16.5Hz), 5.33-5.50(2H, m), 6.04(1H, d, J=8.4Hz), 6.99-7.30(6H, m),
7.55(1H, s), 7.73(1H, d, J=8.4Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3437, 2669, 1741, 1709,
1653, 1510, 1471, 1454 cm⁻¹. [α]_D²⁵+54.2±0.9° (c=1.003, MeOH) 元素分析
25 (C₃₂H₃₇NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 74.27; H, 7.25; N, 2.71; S, 6.20 実測
値 (%) : C, 74.11; H, 7.16; N, 3.15; S, 6.25

化合物番号 II-142

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.49-2.43(14H, m), 3.94(2H, s), 4.22(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.03(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.04(1H, s), 7.17-7.33(6H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3448, 3433, 2669, 1739, 1709, 1645, 1549, 1508, 1471, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+40.5\pm 0.8^\circ$ ($c=1.003$,
 5 MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}\cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 71.95; H, 7.59; N, 3.00; S, 6.86 実測値 (%): C, 71.82; H, 7.49; N, 3.37; S, 6.83

化合物番号 II-143

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.98(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.53-2.50(14H, m), 4.24(2H, s), 4.33(1H, m), 5.35-5.54(2H, m), 6.18(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.19-7.30(6H, m), 7.42(1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.78(1H, s), 8.18(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3442, 2671, 1709, 1651, 1516, 1495, 1471, 1454, cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+53.6\pm 0.9^\circ$ ($c=1.003$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_8\text{S}\cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 74.27; H, 7.25; N, 2.71; S, 6.20 実測値 (%): C, 74.18; H, 7.24; N, 2.90; S, 6.14

15 化合物番号 II-147

mp.117-118°C 300MHz $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94(1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.55-2.42(14H, m), 3.87(3H, s), 4.06 (2H, s), 4.18(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 5.56(1H, brs), 5.89(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.72-6.77(3H, m), 6.87(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.31(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(Nujol): 3373, 3184, 2667, 1705, 1622, 1599, 1547, 1520, 1286 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+42.0\pm 0.8^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{37}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 68.07; H, 7.29; N, 2.74; S, 6.27 実測値 (%): C, 67.84; H, 7.43; N, 2.71; S, 6.18

化合物番号 II-148

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95(1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.53-2.45(14H, m), 3.87(3H, s), 2.96-3.01(2H, m), 3.10-3.16(2H, m), 4.22(1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.01(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.71(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.16-7.32(6H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3450, 3431, 2671, 1739, 1709, 1641, 1545, 1508 cm^{-1} .

$[\alpha]_D^{22} + 44.3 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($C_{29}H_{37}NO_3S \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C, 72.34; H, 7.79; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%) : C, 72.24; H, 7.68; N, 3.11; S, 6.73

化合物番号 II-149

5 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.95(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.45(14H, m), 2.43(3H, d, $J=0.9Hz$), 3.07-3.18(4H, m), 4.21(1H, m), 5.35-5.50(2H, m), 6.02(1H, d, $J=8.4Hz$), 6.53-6.57(2H, m), 6.76 and 7.30(each 1H, each d, each $J=3.9Hz$). IR($CHCl_3$): 3516, 3450, 3431, 2667, 1709, 1641, 1543, 1508 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22} + 43.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($C_{28}H_{37}NO_3S_2 \cdot 0.3H_2O$) 計算値 (%) : C, 66.58; H, 7.50; N, 2.77; S, 12.70 実測値 (%) : C, 66.47; H, 7.46; N, 2.99; S, 12.62

化合物番号 II-150

15 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.95(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.45(14H, m), 3.19(4H, s), 4.21(1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.01(1H, d, $J=8.4Hz$), 6.75(1H, d, $J=3.9Hz$), 6.79(1H, m), 6.91 (1H, dd, $J=3.6$ and $5.1Hz$), 7.13(1H, dd, $J=0.9$ and $5.1Hz$), 7.29(1H, d, $J=3.9Hz$). IR($CHCl_3$): 3514, 3450, 3433, 2667, 1739, 1709, 1641, 1545, 1508 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 33.5 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($C_{27}H_{35}NO_3S_2$) 計算値 (%) : C, 66.77; H, 7.26; N, 2.88; S, 13.20 実測値 (%) : C, 66.48; H, 7.31; N, 2.97; S, 13.22

20 化合物番号 II-151

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.97(1H, d, $J=9.9Hz$), 1.12 and 1.23(each 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 3.00-3.06(2H, m), 3.12-3.17(2H, m), 4.27 (1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.24(1H, d, $J=9.0Hz$), 6.75(1H, m), 6.90(1H, dd, $J=3.6$ and $5.4Hz$), 7.12(1H, dd, $J=1.2$ and $5.4Hz$), 7.25 and 7.64(each 2H, each d-like). IR($CHCl_3$): 3516, 3452, 2665, 1738, 1709, 1649, 1523, 1495 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 54.5 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($C_{29}H_{37}NO_3S$) 計算値 (%) : C, 72.61; H, 7.77; N, 2.92; S, 6.68 実測値 (%) : C, 72.51; H, 7.69; N, 2.98; S, 6.62

化合物番号 II-152

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.23(each 3H, each s), 1.51-2.45(14H, m), 2.92-2.97(2H, m), 3.08-3.13(2H, m), 4.22 (1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.00(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.69(1H, d, $J = 3.6 \text{ Hz}$), 6.92-7.00 (2H, m),
 5 7.09-7.15(2H, m), 7.28(1H, d, $J = 3.6 \text{ Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1543, 1510, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+42.6\pm0.8^\circ$ ($c=1.014$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{36}\text{FNO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 69.99; H, 7.29; N, 2.81; S, 6.44; F, 3.82 実測値 (%) : C, 69.87; H, 7.29; N, 2.88; S, 6.50; F, 3.85

化合物番号 II-156

10 mp.93-95°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.96(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.13 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.47(14H, m), 4.08(2H, s), 4.27(1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.21(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.18-7.32(6H, m), 7.61 and 7.66(each 1H, each s), 7.74(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$). IR(KBr): 3367, 1705, 1618, 1556, 1533, 1508 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+60.4\pm0.8^\circ$ ($c=1.012$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%) : C, 74.53; H, 7.23;
 15 N, 2.72; S, 6.22 実測値 (%) : C, 74.31; H, 7.37; N, 2.99; S, 6.10

化合物番号 II-157

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.06 and 1.19(each 3H, each s), 1.47-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.28(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 5.98(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.80(1H, d, $J=3.3\text{Hz}$), 7.32-7.36(2H, m), 7.41-7.50(2H, m), 7.68(1H, s), 7.77-7.83(3H, m). IR(CHCl_3): 3518, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1545, 1508, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+42.7\pm0.8^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.01; H, 7.26; N, 2.70; S, 6.17 実測値 (%) : C, 73.94; H, 7.30; N, 2.89; S, 6.15

化合物番号 II-158

25 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.95(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.11 and 1.22(each 3H, each s), 1.51-2.45(14H, m), 2.94-3.00(2H, m), 3.06-3.12(2H, m), 3.83 (3H, s), 4.22(1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.00(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.73 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.84-

6.89(2H, m), 7.09(1H, dd, J=1.5 and 7.8Hz), 7.20 (1H, dt, J=1.5 and 7.8Hz),
7.30(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3518, 3450, 3431, 1741, 1709, 1639, 1545,
1506, 1496, 1466 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 41.3 \pm 0.8^\circ$ (c=1.007, MeOH) 元素分析
(C₃₀H₃₉FNO₄S) 計算値 (%): C, 70.69; H, 7.71; N, 2.75; S, 6.29 実測値 (%): C,

5 70.42; H, 7.64; N, 2.78; S, 6.37

化合物番号 II-159

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.10 and 1.22(each 3H, each s),
1.53-2.48(14H, m), 2.96-3.04(2H, m), 3.07-3.16(2H, m), 4.22 (1H, m), 5.34-
5.52(2H, m), 6.04(1H, d, J=8.7Hz), 6.74(1H, d, J = 3.6 Hz), 6.77-6.85 (2H, m),
10 7.05-7.11 (2H, m), 7.31(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 359, 3510, 3429, 3190,
1709, 1636, 1545, 1508, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 42.7 \pm 0.8^\circ$ (c=1.009, MeOH) 元素
分析 (C₂₉H₃₇NO₄S · 0.3H₂O) 計算値 (%): C, 69.51; H, 7.56; N, 2.80; S, 6.40
実測値 (%): C, 69.25; H, 7.43; N, 2.89; S, 6.43

化合物番号 II-160

15 mp.125-126°C 300MHz ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.96(1H, d, J=10.2Hz), 1.13 and
1.23(each 3H, each s), 1.52-2.47(14H, m), 4.10(2H, s), 4.27 (1H, m), 5.34-
5.51(2H, m), 6.20(1H, d, J=9.0Hz), 7.19-7.33(6H, m), 7.62 and 7.69(each 1H,
each s), 7.73(1H, d, J=8.4Hz). IR(KBr): 3415, 3199, 1736, 1703, 1633, 1523
cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 53.3 \pm 0.8^\circ$ (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₃₂H₃₇NO₃S · 0.1H₂O)
20 計算値 (%): C, 74.27; H, 7.25; N, 2.71; S, 6.23 実測値 (%): C, 74.19; H, 7.16;
N, 2.81; S, 6.23

化合物番号 II-161

mp.98-101°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.97(1H, d, J=10.5Hz), 1.14 and 1.24(each
3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 4.08(2H, s), 4.27 (1H, m), 5.35-5.51(2H, m),
25 6.21(1H, d, J=8.7Hz), 6.90(1H, dd, J=1.2 and 5.1Hz), 6.93(1H, m), 7.24-7.29(2H,
m), 7.63(1H, s), 7.75(1H, d, J = 8.1 Hz). IR(KBr): 3394, 3097, 1707, 1643, 1533,
1500 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 58.7 \pm 1.0^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ ·

0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 68.35; H, 6.81; N, 2.66; S, 12.17 実測値 (%) : C, 68.27;
H, 6.76; N, 2.94; S, 12.17

化合物番号 II-162

mp.106-109°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.97(1H, d, J=10.2Hz), 1.14 and 1.24(each
5 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 4.26(2H, s), 4.27(1H, m), 5.35-5.51(2H, m),
6.22(1H, d, J=8.7Hz), 6.82(1H, m), 6.93(1H, dd, J=3.6 and 5.1Hz), 7.16(1H, dd,
J=1.2 and 5.1Hz), 7.32(1H, dd, J=8.1 and 1.8Hz), 7.68(2H, m), 7.76(1H, d,
J=8.1Hz). IR(KBr): 3396, 3070, 1707, 1645, 1535, 1500 cm⁻¹. [α]_D²⁵+59.9±
1.0° (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.59;
10 H, 6.79; N, 2.67; S, 12.21 実測値 (%) : C, 68.57; H, 6.62; N, 2.76; S, 12.17

化合物番号 II-163

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
1.49-2.44(14H, m), 4.12(2H, s), 4.23(1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.09(1H, d,
J=8.7Hz), 6.82 and 6.93(each 1H, each m), 7.13-7.17 (2H, m), 7.34(1H, d,
15 J=1.5Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3448, 3431, 1739, 1709, 1645, 1550, 1508, 1471,
1456 cm⁻¹. [α]_D²⁵+43.3±0.8° (c=1.007, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₃NO₃S₂ ·
0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 65.95; H, 7.07; N, 2.96; S, 13.54 実測値 (%) : C, 66.12;
H, 7.06; N, 3.04; S, 13.66

化合物番号 II-164

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=10.5Hz), 1.09 and 1.22 (each 3H, each s),
20 1.49-2.44(14H, m), 3.95(2H, s), 4.22(1H, m), 5.34-5.49 (2H, m), 6.06(1H, d,
J=8.7Hz), 6.92 and 6.96(each 1H, each m), 7.07(1H, d, J=1.5Hz), 7.28(1H, m),
7.30(1H, d, J=1.5Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3431, 1739, 1709, 1645, 1550, 1508,
1471 cm⁻¹. [α]_D²⁵+41.1±0.8° (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₃NO₃S₂ ·
25 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 65.70; H, 7.08; N, 2.95; S, 13.49 実測値 (%) : C, 65.57;
H, 6.97; N, 3.08; S, 13.63

化合物番号 II-165

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.22(each 3H, each s),
 1.50-2.44(14H, m), 3.74(2H, s), 4.23(1H, m), 5.34-5.50(2H, m), 6.07(1H, d,
 $J=8.0\text{Hz}$), 6.23(1H, s), 7.08(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 7.24(1H, s), 7.31(1H, d, $J=1.5\text{Hz}$),
 7.36(1H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3448, 3431, 2663, 1709, 1645, 1550, 1508, 1471
 5 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+44.2\pm0.8^\circ$ ($c=1.001$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$)
 計算値 (%) : C, 68.00; H, 7.33; N, 3.05; S, 6.98 実測値 (%) : C, 68.00; H, 7.30;
 N, 3.15; S, 7.12

化合物番号 II-166

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.05 and 1.19(each 3H, each s),
 10 1.48-2.40(14H, m), 4.17(1H, m), 4.58(2H, s), 5.31-5.46(2H, m), 5.96(1H, d,
 $J=8.7\text{Hz}$), 6.72 and 7.26(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$), 7.37-7.51(4H, m),
 7.79(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.87 and 7.97 (each 1H, each m). IR(CHCl_3): 3516, 3450,
 3431, 2667, 1739, 1709, 1641, 1543, 1508, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25.5}+41.9\pm0.8^\circ$
 (c=1.011, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.01; H,
 15 7.26; N, 2.70; S, 6.17 実測値 (%) : C, 74.10; H, 7.13; N, 2.99; S, 6.15

化合物番号 II-167

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.05 and 1.20(each 3H, each s),
 1.48-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.39(2H, m), 5.31-5.46(2H, m), 6.00(1H, d,
 $J=9.0\text{Hz}$), 6.96(1H, s), 7.30-7.33(2H, m), 7.40-7.50 (3H, m), 7.78(1H, d,
 20 $J=8.1\text{Hz}$), 7.87 and 7.95(each 1H, each m). IR(CHCl_3): 3518, 3448, 3431, 2665,
 1738, 1709, 1645, 1549, 1508, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+37.9\pm0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH)
 元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 74.27; H, 7.25; N, 2.71; S, 6.20
 実測値 (%) : C, 74.13; H, 7.18; N, 2.87; S, 6.26

化合物番号 II-169

25 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.98(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.10 and 1.23(each 3H, each
 s), 1.53-2.50(14H, m), 4.23(2H, s), 4.33(1H, m), 5.35-5.54(2H, m), 6.18(1H, d,
 $J=8.7\text{Hz}$), 6.92(1H, dd, $J=1.2$ and 4.8Hz), 7.01(1H, m), 7.22(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$),

7.24(1H, dd, J=3.0 and 4.8Hz), 7.42(1H, d, J=7.8 and 8.1Hz), 7.79(1H, s),
8.18(1H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3442, 2667, 1709, 1651, 1516, 1495,
1471 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{26} + 50.9 \pm 0.9^\circ$ (c=1.009, MeOH), 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ ·
0.2H₂O) 計算値 (%): C, 68.59; H, 6.79; N, 2.67; S, 12.21 実測値 (%): C, 68.51;

5 H, 6.69; N, 2.73; S, 12.39

化合物番号 II-170

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.99(1H, d, J=10.2Hz), 1.11 and 1.24(each 3H, each s),
1.53-2.50(14H, m), 4.03(2H, s), 4.34(1H, m), 5.36-5.54 (2H, m), 6.20(1H, d,
J=8.4Hz), 7.24(1H, d, J=8.4Hz), 7.24(1H, d, J = 7.2 Hz), 7.30(1H, m), 7.35(1H,
10 t, J=1.8Hz), 7.42(1H, dd, J=7.2 and 8.1 Hz), 7.81(1H, s), 8.19(1H, d, J=7.2Hz).
IR(CHCl₃): 3518, 3442, 1739, 1709, 1651, 1516, 1496, 1471 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 54.3$
 $\pm 1.0^\circ$ (c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₄S · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 71.00;
H, 6.99; N, 2.76; S, 6.32 実測値 (%): C, 70.95; H, 6.82; N, 2.74; S, 6.35

化合物番号 II-173

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.99(1H, d, J=10.5Hz), 1.16 and 1.24(each 3H, each s),
1.53-2.48(14H, m), 3.93(2H, s), 4.32(1H, m), 5.34-5.52(2H, m), 6.35(1H, d,
J=8.7Hz), 7.31-7.42(2H, m), 7.56(1H, d, J=6.9Hz), 7.71(1H, dd, J=1.5 and
8.1Hz), 7.78-7.83(2H, m), 7.92(1H, s). IR (CHCl₃): 3516, 3452, 3026, 2667,
1738, 1709, 1649, 1641, 1514, 1481, 1469, 1454 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 67.5 \pm 1.1^\circ$
20 (c=1.005, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%): C, 78.43; H, 7.72;
N, 3.05 実測値 (%): C, 78.36; H, 7.99; N, 3.24

化合物番号 II-174

¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.09 and 1.21(each 3H, each
s), 1.50-2.42(14H, m), 3.21(2H, t, J=8.7Hz), 4.02(2H, s), 4.20 (1H, m), 4.59(2H, t,
25 J=8.7Hz), 5.34-5.49(2H, m), 6.01(1H, d, J = 8.7 Hz), 6.80 (1H, d, J=3.6Hz),
7.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.19(1H, m), 7.30 (1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3512,
3450, 3431, 2667, 1739, 1709, 1641, 1543, 1508, 1460 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 35.7 \pm 0.8^\circ$

(c=1.002, MeOH), 元素分析 ($C_{30}H_{36}BrNO_4S$) 計算値 (%) : C, 61.43; H, 6.19; Br, 13.62; N, 2.39; S, 5.47 実測値 (%) : C, 61.26; H, 6.11; Br, 13.54; N, 2.46; S, 5.47

化合物番号 II-175

- 5 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.96(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.14 and 1.23(each 3H, each s), 1.52-2.46(14H, m), 4.21((2H, s), 4.28(1H, m), 5.34-5.51(2H, m), 6.23(1H, d, $J=9.0Hz$), 6.94(1H, dd, $J=1.2$ and 4.8Hz), 7.05(1H, m), 7.21-7.26(2H, m), 7.35(1H, dd, $J=7.5$ and 8.1Hz), 7.71(1H, d, $J=7.5Hz$), 7.75(1H, s). IR($CHCl_3$): 3510, 3448, 3427, 2665, 1709, 1649, 1539, 1504, 1469, 1454 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+47.4 \pm 0.9^\circ$ (c=1.005, MeOH), 元素分析 ($C_{32}H_{37}NO_5S \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C, 74.27; H, 7.25; N, 2.71; S, 6.20 実測値 (%) : C, 74.15; H, 7.14; N, 2.89; S, 6.26
- 10 化合物番号 II-176

- 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.97(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.14 and 1.24(each 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 4.22((2H, s), 4.27(1H, m), 5.35-5.51(2H, m), 6.22(1H, d, $J=8.7Hz$), 6.94(1H, dd, $J=1.2$ and 4.8Hz), 7.05(1H, m), 7.21-7.26(2H, m), 7.35(1H, dd, $J=7.5$ and 8.1Hz), 7.71(1H, d, $J=7.5Hz$), 7.75(1H, s). IR($CHCl_3$): 3512, 3448, 3427, 2665, 1709, 1649, 1539, 1504, 1469 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+46.1 \pm 0.9^\circ$ (c=1.011, MeOH), 元素分析 ($C_{30}H_{36}NO_5S_2$) 計算値 (%) : C, 69.06; H, 6.76; N, 2.68; S, 12.29 実測値 (%) : C, 68.77; H, 6.84; N, 2.78; S, 12.30
- 15 化合物番号 II-177

- 1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.96(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.14 and 1.24(each 3H, each s), 1.53-2.46(14H, m), 2.31(3H, s), 4.17((2H, s), 4.28(1H, m), 5.34-5.51 (2H, m), 6.22(1H, d, $J=9.0Hz$), 7.09 and 7.15(each 2H, each d, $J=7.8Hz$), 7.19(1H, d, $J=7.2Hz$), 7.34(1H, dd, $J=7.2$ and 7.8Hz), 7.70 (1H, d, $J=7.8Hz$), 7.75(1H, s).
- 20 IR($CHCl_3$): 3510, 3448, 3427, 2669, 1709, 1649, 1537, 1504, 1469 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+45.6 \pm 0.9^\circ$ (c=1.005, MeOH), 元素分析 ($C_{33}H_{39}NO_3S \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C, 74.57; H, 7.43; N, 2.64; S, 6.03 実測値 (%) : C, 74.46; H, 7.48; N, 2.78;

S, 6.15

化合物番号 II-178

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.97(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.14 and 1.24(each 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 2.31(3H, s), 4.28(1H, m), 4.40((2H, s), 5.35-5.51 (2H, m),
 5 6.23(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.92-6.94(2H, m), 7.16(1H, dd, $J=1.5$ and 5.1Hz), 7.28(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.36(1H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 7.72 (1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.75(1H, s).
 $\text{IR}(\text{CHCl}_3)$: 3508, 3448, 3427, 2663, 1709, 1649, 1539, 1504, 1469 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{25}+46.2\pm0.9^\circ$ ($c=1.005$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 69.06; H, 6.76; N, 2.68; S, 12.29 実測値 (%) : C, 68.84; H, 6.86; N, 2.79; S, 12.28

10 化合物番号 II-179

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.51-2.42(14H, m), 4.09(2H, s), 4.18(1H, m), 5.33-5.48(2H, m), 5.96(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.54(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.24-7.42(10H, m). $\text{IR}(\text{CHCl}_3)$: 3510, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1479, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24.5}+39.4\pm0.8^\circ$
 15 ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{34}\text{H}_{39}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 75.13; H, 7.27; N, 2.58; S, 5.90 実測値 (%) : C, 75.05; H, 7.32; N, 2.69; S, 6.17

化合物番号 II-180

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.00(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.15 and 1.26(each 3H, each s), 1.55-2.49(14H, m), 4.30(1H, m), 5.37-5.53(2H, m), 6.38(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$),
 20 7.32(1H, m), 7.49-7.58(3H, m), 7.64-7.67(2H, m), 7.92 (1H, s). $\text{IR}(\text{CHCl}_3)$: 3514, 3446, 1714, 1655, 1618, 1514, 1469, 1446 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+66.7\pm1.1^\circ$
 ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{33}\text{NO}_4 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 75.83; H, 7.08; N, 2.95 実測値 (%) : C, 75.69; H, 7.05; N, 3.08

化合物番号 II-181

25 mp.103-104°C 300MHz $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 3.79(3H, s), 4.07 ((2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.48(2H, m), 5.98(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.75 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.85 and

7.15(each 2H, each d, J=8.4Hz), 7.31 (1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3519, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1612, 1543, 1510, 1464 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 43.8 \pm 0.8^\circ$ (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₉H₃₇NO₄S) 計算値 (%) : C, 70.27; H, 7.52; N, 2.83; S, 6.47 実測値 (%) : C, 70.33; H, 7.55; N, 3.05; S, 6.46

5 化合物番号 II-182

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.5Hz), 1.07 and 1.21(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.37(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, J=8.4Hz), 6.82(1H, d, J=3.6Hz), 7.21(1H, s), 7.30 (1H, d, J=3.6Hz), 7.34-7.37(2H, m), 7.69(1H, m), 7.86(1H, m). IR (CHCl₃): 3512, 3450, 3431, 2671, 1739, 1709, 1643, 1543, 1508, 1471, 1460 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 40.2 \pm 0.8^\circ$ (c=1.005, MeOH), 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ · 0.4H₂O) 計算値 (%) : C, 68.12; H, 6.82; N, 2.64; S, 12.12 実測値 (%) : C, 68.05; H, 6.70; N, 2.87; S, 12.00

化合物番号 II-183

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.47(14H, m), 4.13(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.50(2H, m), 6.01(1H, d, J=9.0Hz), 6.80(1H, m), 6.82(1H, m), 6.86(1H, m), 7.12 (1H, m), 7.15(1H, m), 7.31(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3597, 3510, 3448, 3427, 3190, 1709, 1633, 1545, 1508, 1456 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 41.8^\circ \pm 0.8^\circ$ (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₈H₃₅NO₄S · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 69.11; H, 7.37; N, 2.88; S, 6.59 実測値 (%) : C, 68.94; H, 7.42; N, 2.96; S, 6.73

化合物番号 II-184

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.00(1H, d, J=10.5Hz), 1.17 and 1.25(each 3H, each s), 1.55-2.50(14H, m), 3.93 (2H, s), 4.32(1H, m), 5.35-5.49(2H, m), 6.37(1H, d, J=8.7Hz), 7.31-7.43(2H, m), 7.54-7.63(3H, m), 7.84 (1H, d, J=7.2Hz), 8.16(1H, s). IR (CHCl₃): 3514, 3450, 2667, 1709, 1651, 1572, 1514, 1481, 1452 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 58.3 \pm 1.0^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 78.43; H, 7.72; N, 3.05 実測値 (%) : C, 78.26; H, 7.73; N, 3.28

化合物番号 II-185

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s),
 1.52-2.42(14H, m), 4.16(2H, s), 4.19(1H, m), 5.33-5.47(2H, m), 5.99(1H, d,
 $J=9.3\text{Hz}$), 6.78(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.00-7.12(2H, m), 7.20-7.27 (2H, m), 7.30(1H,
 5 d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3510, 3450, 3431, 1741, 1709, 1643, 1543, 1508, 1456
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+38.0\pm 0.8^\circ$ ($c=1.03$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{FNO}_3\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$)
 計算値 (%) : C, 68.26; H, 7.16; N, 2.86; S, 6.51; F, 3.86 実測値 (%) : C, 68.24;
 H, 7.08; N, 2.93; S, 6.50; F, 3.80

化合物番号 II-188

10 mp.53-55°C 300MHz $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and
 1.21(each 3H, each s), 1.51-2.42(14H, m), 4.07(2H, s), 4.19 (1H, m), 5.05(2H, s),
 5.33-5.48(2H, m), 5.98(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.76 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.92 and
 7.15(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.31(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.32.-7.43 (5H, m)
 IR(CHCl_3): 3518, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1612, 1545, 1510, 1469, 1456
 15 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+36.0\pm 0.8^\circ$ ($c=1.005$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{35}\text{H}_{41}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$)
 計算値 (%) : C, 72.61; H, 7.28; N, 2.42; S, 5.54 実測値 (%) : C, 72.58; H, 7.33;
 N, 2.65; S, 5.53

化合物番号 II-189

300MHz $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.21 (each 3H,
 20 each s), 1.51-2.42(14H, m), 4.07(2H, s), 4.19(1H, m), 4.51-4.53 (2H, m), 5.26-
 5.46(4H, m), 5.98(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.05(1H, m), 6.76 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.87 and
 7.14(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.31 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3511, 3450,
 3431, 1741, 1709, 1641, 1612, 1543, 1508, 1471, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+39.7\pm 0.8^\circ$
 ($c=1.008$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{39}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 70.88; H,
 25 7.56; N, 2.67; S, 6.10 実測値 (%) : C, 70.86; H, 7.60; N, 2.68; S, 6.17

化合物番号 II-190

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each

s), 1.50-2.43(14H, m), 4.04(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 5.94(2H, s),
 5.98(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.68-6.78(4H, m), 7.31(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3):
 3518, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1543, 1504, 1489, 1444, 1250, 1041 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24}+42.2\pm0.8^\circ$ ($c=1.010$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%): C,
 5 68.34; H, 6.92; N, 2.75; S, 6.29 実測値 (%): C, 68.19; H, 6.88; N, 2.86; S, 6.20
 化合物番号 II-191

mp.76-80°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.94(1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.09 and 1.21 (each 3H,
 each s), 1.51-2.43(14H, m), 4.13(2H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.00(1H,
 d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.78(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 6.90-7.04 (3H, m), 7.27(1H, m), 7.32(1H, d,
 10 $J=3.9\text{Hz}$). IR(Nujol): 3408, 1703, 1631, 1514, 1250 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+51.0\pm0.9^\circ$
 ($c=1.001$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{FNO}_3\text{S}$) 計算値 (%): C, 69.54; H, 7.09; N,
 2.90; S, 6.63; F, 3.93 実測値 (%): C, 69.77; H, 7.23; N, 2.95; S, 6.55; F, 3.93
 化合物番号 II-192

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each
 15 s), 1.51-2.44(14H, m), 4.19(2H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.00(1H, d,
 $J=8.4\text{Hz}$), 6.78 and 7.32(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.40-7.54(4H, m).
 IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1643, 1543, 1508, 1331, 1167, 1130
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+39.5\pm0.8^\circ$ ($c=1.012$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{34}\text{F}_3\text{NO}_3\text{S}$) 計算値
 (%): C, 65.27; H, 6.42; N, 2.62; S, 6.01; F, 10.68 実測値 (%): C, 65.05; H, 6.46;
 20 N, 2.74; S, 6.02; F, 10.63

化合物番号 II-193
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s),
 1.51-2.26(14H, m), 4.19(1H, m), 4.26(2H, s), 5.33-5.49(2H, m), 6.00(1H, d,
 $J=8.4\text{Hz}$), 6.79(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.20-7.25(3H, m), 7.30(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.37-
 25 7.40(1H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1643, 1543, 1508, 1471
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+38.5\pm0.8^\circ$ ($c=1.00$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{FNO}_3\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計
 算値 (%): C, 66.06; H, 6.93; N, 2.75; S, 6.30; Cl, 6.96 実測値 (%): C, 66.21;

H, 6.87; N, 2.97; S, 6.24; Cl, 6.75

化合物番号 II-194

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.20(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 2.30(6H, s), 4.15(2H, s), 4.19(1H, m), 5.33-5.48 (2H, m), 5.97(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.56(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.03-7.13 (3H, m), 7.26(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3518, 3450, 3431, 2671, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+43.7\pm0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{80}\text{H}_{88}\text{FNO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 72.72; H, 7.97; N, 2.83; S, 6.47 実測値 (%): C, 72.68; H, 7.95; N, 2.96; S, 6.48

10 化合物番号 II-195

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.53-2.50(14H, m), 4.19(1H, m), 4.32(2H, s), 5.34-5.47(2H, m), 6.00(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.28-7.39(3H, m), 7.50 (1H, m), 7.66(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 2669, 1741, 1709, 1643, 1543, 1508, 1456, 1315, 1163, 1126, 1059, 1038 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+36.4\pm0.7^\circ$ ($c=1.03$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{34}\text{F}_3\text{NO}_3\text{S}$) 計算値 (%): C, 65.27; H, 6.42; N, 2.62; S, 6.01 実測値 (%): C, 65.34; H, 6.30; N, 2.82; S, 6.00

化合物番号 II-197

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.08 and 1.20(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 3.22(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 4.07(2H, s), 4.20 (1H, m), 4.57(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 5.33-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.79 (1H, t, 7.5Hz), 6.80(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.95(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.09(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.30(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3450, 3431, 2667, 1739, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+42.0\pm0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 70.72; H, 7.36; N, 2.75; S, 6.29 実測値 (%): C, 70.59; H, 7.39; N, 2.95; S, 6.31

化合物番号 II-198

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.92 (1H, d, J=10.5Hz), 1.07 and 1.19 (each 3H, each s), 1.47-2.41(14H, m), 4.20(1H, m), 4.24(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 6.00(1H, d, J=8.7Hz), 6.78(1H, d, J=3.9Hz), 7.21(1H, dd, J=1.8 and 8.4Hz), 7.26(1H, d, J=5.7Hz), 7.33(1H, d, J=3.9Hz), 7.43(1H, d, J=5.7Hz), 7.67(1H, d, J=1.8Hz),
5 7.81(1H, d, J=8.4Hz) . IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1545, 1458 cm⁻¹. [α]_D²⁵+40.9±0.8° (c=1.002, MeOH), 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 68.36; H, 6.81; N, 2.66; S, 12.17 実測値 (%) : C, 68.30; H, 6.68; N, 2.94; S, 12.25

化合物番号 II-199

10 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.5Hz), 1.07 and 1.20(each 3H, each s), 1.49-2.42(14H, m), 4.20(1H, m), 4.27(2H, s), 5.32-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, J=8.7Hz), 6.80(1H, d, J=3.6Hz), 7.24(1H, dd, J=1.5 and 8.1Hz), 7.31(1H, dd, J=0.6 and 5.4Hz), 7.33(1H, d, J=3.6Hz), 7.40 (1H, d, J=5.4Hz), 7.73(1H, m), 7.77(1H, d, J=8.1Hz) . IR (CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1543,
15 1508, 1469 cm⁻¹. [α]_D²⁵+41.5 ± 0.8 ° (c=1.002, MeOH), 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 68.36; H, 6.81; N, 2.66; S, 12.17 実測値 (%) : C, 68.37; H, 6.73; N, 2.86; S, 12.21

化合物番号 II-200

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.06 and 1.19(each 3H, each s), 1.48-2.41(14H, m), 4.19(1H, m), 4.39(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 5.99(1H, d, J=8.7Hz), 6.86(1H, d, J=3.6Hz), 7.21(1H, d, J=7.2 Hz), 7.30(1H, d, J=3.6Hz), 7.35(1H, t, J=7.2Hz), 7.36(1H, d, J=5.4 Hz), 7.42(1H, d, J=5.4Hz), 7.74(1H, d, J=7.2Hz) . IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1543, 1508, 1471, 1460 cm⁻¹. [α]_D²⁵+42.0±0.8° (c=1.001, MeOH), 元素分析 (C₃₀H₃₅NO₃S₂ ·
25 0.3H₂O) 計算値 (%) : C, 68.36; H, 6.81; N, 2.66; S, 12.17 実測値 (%) : C, 68.63; H, 6.78; N, 2.84; S, 12.26

化合物番号 II-201

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.20(each 3H, each s), 1.52-2.47(14H, m), 4.20(1H, m), 4.23(2H, s), 5.32-5.51(2H, m), 6.08(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.75(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.95(1H, dd, $J=2.4$ and 9.0Hz), 7.10(1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.19(1H, s), 7.27(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.66(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$).

5 IR(CHCl_3): 3427, 3249, 1707, 1633, 1601, 1545, 1510, 1442 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+40.1 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{80}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.34; H, 6.61; N, 2.58; S, 11.81 実測値 (%) : C, 66.21; H, 6.70; N, 2.70; S, 11.75
化合物番号 II-202

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
10 1.53-2.45(14H, m), 4.17(1H, m), 4.24(2H, m), 4.69(2H, m), 5.35-5.47(2H, m), 6.02(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.72(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.23-7.31(4H, m), 7.40(1H, m).
IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1709, 1641, 1527, 1508, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26}+32.7 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.00$, CHCl_3)

化合物番号 II-203

15 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.54-2.48(18H, m), 3.20 (4H, m), 4.11-4.22(3H, m), 4.43(2H, s), 5.33-5.55(2H, m), 5.99(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.67(1H, d, $J=4.2\text{Hz}$), 7.30-7.43 (4H, m), 7.64(1H, d, $J=4.2\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3448, 3420, 2555, 2459, 1711, 1643, 1543, 1508, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26}+20.4 \pm 0.6^\circ$ ($c=1.05$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{33}\text{H}_{44}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 1.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.71; H, 8.19; N, 4.93; S, 5.64 実測値 (%) : C, 69.69; H, 8.08; N, 4.92; S, 5.54

化合物番号 II-204

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.21(each 3H, each s), 1.53-2.46(14H, m), 2.49(6H, s), 3.79(1H, d, $J=10.8\text{Hz}$), 3.84 (1H, d, $J=10.8\text{Hz}$),
25 4.19(1H, m), 4.35(1H, d, $J=20.1\text{Hz}$), 4.37(1H, d, $J=20.1\text{Hz}$), 5.36-5.54 (2H, m), 5.94(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.71(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.25-7.43(5H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3448, 3429, 2553, 2459, 1711, 1643, 1545, 1506, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26}+20.9$

$\pm 0.6^\circ$ ($c=1.03$, CHCl_3) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{42}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 3.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.35;
H, 8.40; N, 4.84; S, 5.54 実測値 (%): C, 64.36; H, 7.87; N, 4.63; S, 5.17

化合物番号 II-205

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.98(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.13 and 1.24(each 3H, each s),
5 1.53-2.47(14H, m), 3.20-3.27(4H, m), 4.28(1H, m), 5.35-5.51 (2H, m), 6.32(1H, d,
 $J=8.4\text{Hz}$), 7.24(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.34 and 7.46 (each 1H, each m), 7.55(1H, dd,
 $J=1.8$ and 8.4Hz), 7.67(1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.00-8.04(2H, m). IR(CHCl_3): 3518,
3448, 1709, 1649, 1597, 1514, 1294 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25} +58.8 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.001$, MeOH)
元素分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{37}\text{NO}_4 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 76.37; H, 7.49; N, 2.78 実測値
10 (%): C, 76.33; H, 7.50; N, 2.88

化合物番号 II-206

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.22(each 3H, each s),
1.51-2.43(14H, m), 3.97(2H, s), 4.21(1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.07(1H, d,
 $J=3.3\text{Hz}$), 6.38(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.98-7.04(3H, m), 7.13-7.22(2H, m).
15 IR(CHCl_3): 3518, 3438, 1739, 1709, 1651, 1606, 1549, 1508 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{26} +57.2$
 $\pm 1.0^\circ$ ($c=1.016$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{34}\text{FNO}_4 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 71.65;
H, 7.34; N, 2.98; F, 4.05 実測値 (%): C, 71.57; H, 7.44; N, 3.14; F, 4.01

化合物番号 II-207

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.96(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.21(each 3H, each s),
20 1.52-2.43(14H, m), 4.00(2H, s), 4.21(1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.09(1H, d,
 $J=3.3\text{Hz}$), 6.40(1H, d, $J=9.6\text{Hz}$), 7.01(1H, d, $J=3.3\text{ Hz}$), 7.22-7.36(5H, m).
IR(CHCl_3): 3516, 3439, 2667, 1738, 1709, 1651, 1606, 1547, 1498 cm^{-1} .
 $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +62.2 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値
(%): C, 74.21; H, 7.87; N, 3.09 実測値 (%): C, 74.14; H, 7.81; N, 3.25

25 化合物番号 II-208

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.20(each 3H, each
s), 1.48-2.42(14H, m), 4.19(1H, m), 4.42(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 5.98(1H, d,

J=8.7Hz), 6.78(1H, d, J=2.1Hz), 6.84(1H, d, J=3.9 Hz), 7.13(1H, dd, J=1.5 and 7.5Hz), 7.19(1H, t, J=7.5Hz), 7.30(1H, d, J=3.9Hz), 7.50(1H, dd, J=1.5 and 7.5Hz), 7.63(1H, d, 2.1Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1543, 1508, 1471, 1458, 1427 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} + 43.5 \pm 0.8^\circ$ (c=1.010, MeOH), 元
5 素分析 (C₈₀H₃₆NO₄S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 70.75; H, 7.01; N, 2.75; S, 6.30
実測値 (%) : C, 70.80; H, 7.02; N, 2.96; S, 6.26

化合物番号 II-209

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=10.2Hz), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
1.55-2.41(14H, m), 2.95(3H, s), 4.18-4.21(3H, m), 4.45(2H, s), 5.39-5.43(2H, m),
10 6.00(1H, d, J=8.7Hz), 6.63-6.71(4H, m), 7.16-7.26(6H, m), 7.32(1H, m).
IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1643, 1599, 1543, 1505, 1454 cm⁻¹.
 $[\alpha]_D^{26} + 32.2 \pm 0.7^\circ$ (c=1.00, CHCl₃) 元素分析 (C₃₆H₄₄N₂O₃S · 0.6H₂O) 計算値
(%) : C, 72.59; H, 7.65; N, 4.70; S, 5.38 実測値 (%) : C, 72.68; H, 7.47; N, 4.74;
S, 5.29

15 化合物番号 II-211

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=9.9Hz), 1.07 and 1.20(each 3H, each s), 1.49-
2.41(14H, m), 4.19(1H, m), 4.30(2H, s), 5.32-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, J=9.0Hz),
6.82(1H, d, J=3.6Hz), 7.24(1H, dd, J=1.5 and 8.1Hz), 7.30-7.36(2H, m), 7.41-
7.47(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.1 Hz), 7.87-7.94(2H, m). IR(CHCl₃): 3510, 3450,
20 3431, 2669, 1739, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458, 1429 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 39.4 \pm 0.8^\circ$
(c=1.002, MeOH) 元素分析 (C₈₄H₃₇NO₄S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 73.25; H,
6.73; N, 2.51; S, 5.75 実測値 (%) : C, 73.13; H, 6.53; N, 2.69; S, 5.79

化合物番号 II-212

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
25 1.50-2.43(14H, m), 3.79 and 3.86(each 3H, each s), 4.14(2H, s), 4.19(1H, m),
5.33-5.48(2H, m), 5.96(1H, d, J=8.4Hz), 6.78-6.85 (3H, m), 7.00(1H, t, J=8.1Hz),
7.30(1H, d, J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2667, 1739, 1709, 1641,

1543, 1506, 1481, 1273, 1076 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26} + 39.6 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{39}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 68.31; H, 7.49; N, 2.66; S, 6.08 実測値 (%) : C, 68.17; H, 7.50; N, 2.76; S, 6.13

化合物番号 II-213

- 5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22 (each 3H, each s), 1.51-2.45(14H, m), 2.39(3H, s), 4.15(2H, s), 4.21(1H, m), 5.34-5.50 (2H, m), 5.87(1H, s), 6.04(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.86(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.32(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3450, 3431, 1709, 1645, 1608, 1545, 1508, 1471, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 47.0 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.017$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算
- 10 値 (%) : C, 65.60; H, 7.33; N, 5.88; S, 6.74 実測値 (%) : C, 65.49; H, 7.31; N, 6.00; S, 6.86

化合物番号 II-214

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 2.33(3H, s), 3.82(3H, s), 4.07(2H, s), 4.18 (1H, m), 5.33-5.48(2H, m), 5.96(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.69(1H, s), 6.74 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.03(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.28 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1639, 1614, 1543, 1506, 1464 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 43.3 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.012$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{39}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 70.45; H, 7.73; N, 2.74; S, 6.27 実測値 (%) : C, 70.35; H, 7.78; N, 2.96; S, 6.20

- 20 化合物番号 II-215

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.21(each 3H, each s), 1.49-2.43(14H, m), 3.84(3H, s), 4.20(1H, m), 4.32(2H, s), 5.33-5.48(2H, m), 5.99(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.83(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.01 (1H, dd, $J=2.4$ and 8.7Hz), 7.12(1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.21(1H, s), 7.31 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.71(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1643, 1601, 1543, 1508, 1458, 1427 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 38.5 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{37}\text{NO}_4\text{S}_2 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 67.26; H, 6.72; N, 2.53; S, 11.58 実測値 (%) : C, 67.24; H, 6.73;
- 25

N, 2.77; S, 11.51

化合物番号 II-216

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.07 and 1.20(each 3H, each s),
1.50-2.42(14H, m), 3.87(2H, s), 4.18(1H, m), 4.20(2H, s), 5.32-5.48 (2H, m),
5 5.98(1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 6.81(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.23-7.41 (5H, m), 7.53(1H, d,
 $J=7.5\text{Hz}$), 7.71-7.77(2H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641,
1545, 1506, 1469, 1456 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+38.5\pm0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析
($\text{C}_{35}\text{H}_{39}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 75.42; H, 7.13; N, 2.51; S, 5.75 実測値
(%): C, 75.36; H, 7.18; N, 2.79; S, 5.50

10 化合物番号 II-217

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.96(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.10 and 1.21(each 3H, each s),
1.52-2.44(14H, m), 3.14-3.24(4H, m), 4.13(2H, s), 4.24(1H, m), 5.32-5.49(2H, m),
6.19(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.06-7.18(4H, m), 7.22 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.39(1H, dd,
 $J=1.8$ and 8.1Hz), 7.51(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3452, 1738, 1709,
15 1649, 1570, 1518, 1491, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+54.4\pm0.9^\circ$ ($c=1.002$, MeOH) 元素
分析 ($\text{C}_{32}\text{H}_{39}\text{NO}_4 \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 78.85; H, 8.11; N, 2.87 実測値 (%):
C, 78.74; H, 8.14; N, 3.17

化合物番号 II-218

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
20 1.50-2.43(14H, m), 3.83, 3.85 and 3.86(each 3H, each s), 4.07 (2H, s), 4.19(1H,
m), 5.33-5.49(2H, m), 5.97(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.62 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.76(1H, td,
 $J=0.9$ and 3.6Hz), 6.87(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.30 (1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3):
3516, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1603, 1543, 1495, 1469, 1277, 1259, 1097
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25}+38.4\pm0.8^\circ$ ($c=1.013$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{41}\text{NO}_6\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計
25 算値 (%): C, 66.57; H, 7.46; N, 2.50; S, 5.73 実測値 (%): C, 66.54; H, 7.42; N,
2.61; S, 5.71

化合物番号 II-219

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.42(14H, m), 2.18 and 2.29(each 3H, each s), 4.14(2H, s), 4.19(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 5.96(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.67(1H, td, $J=0.9$ and 3.6Hz), 7.02-7.12(3H, m), 7.29(1H, t, $J=3.6\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1543, 1506, 1471 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{26}+42.8\pm0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{39}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 72.98; H, 7.96; N, 2.84; S, 6.50 実測値 (%) : C, 72.67; H, 7.98; N, 2.94; S, 6.38

化合物番号 II-220

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.95(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s), 1.51-2.44(14H, m), 3.83(3H, s), 3.84(6H, s), 4.07(2H, s), 4.20 (1H, m), 5.34-5.49(2H, m), 6.00(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.45(2H, s), 6.79 and 7.31 (each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450, 3431, 1741, 1709, 1641, 1593, 1543, 1506, 1464, 1421, 1331, 1240, 1130 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+38.3\pm0.8^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{31}\text{H}_{41}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.57; H, 7.46; N, 2.50; S, 5.73 実測値 (%) : C, 66.48; H, 7.37; N, 2.59; S, 5.63

化合物番号 II-221

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.43(14H, m), 4.08(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 5.95(2H, s), 5.99(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.68-6.82(4H, m), 7.30(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3450, 3431, 1739, 1709, 1641, 1545, 1506, 1460, 1252, 1063 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+41.8\pm0.8^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 68.34; H, 6.92; N, 2.75; S, 6.29 実測値 (%) : C, 68.04; H, 6.90; N, 2.79; S, 6.29

化合物番号 II-222

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.92(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.51-2.45(14H, m), 2.14(3H, s), 4.08(2H, s), 4.18(1H, m), 5.32-5.50 (2H, m), 6.08(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.76(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.97 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.24(1H, t, $J=8.4\text{Hz}$), 7.30(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.38-7.40 (2H, m), 7.74(1H, br s). IR(CHCl_3):

3514, 3435, 3311, 1705, 1639, 1612, 1534, 1508, 1439 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{25} + 40.1 \pm 0.8^\circ$

($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{38}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 68.00; H,

7.38; N, 5.29; S, 6.05 実測値 (%) : C, 68.11; H, 7.17; N, 5.22; S, 5.93

化合物番号 II-223

- 5 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.5\text{Hz}$), 1.09 and 1.22(each 3H, each s),
1.53-2.50(14H, m), 2.99(3H, s), 4.13(2H, s), 4.21(1H, m), 5.34-5.52 (2H, m),
6.02(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 6.80(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.04-7.07(2H, m), 7.16(1H, m),
7.25-7.32(3H, m). IR(CHCl_3): 3510, 3440, 3431, 3371, 1709, 1639, 1608, 1543,
1508, 1471, 1386, 1335, 1151 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} + 38.3 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素
10 分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{38}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 61.94; H, 6.88; N, 4.98; S, 11.40
実測値 (%) : C, 61.99; H, 6.92; N, 4.95; S, 10.97

化合物番号 II-224

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.09 and 1.21(each 3H, each s),
1.50-2.44(14H, m), 4.21(1H, m), 4.32(2H, s), 5.34-5.50(2H, m), 6.01(1H, d,
15 $J=9.0\text{Hz}$), 6.86, 6.88 and 7.14(each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.23-7.37(4H, m),
7.53-7.56(2H, m).

化合物番号 II-225

- $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94 (1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
1.50-2.43(14H, m), 4.08(2H, s), 4.17-4.30(5H, m), 5.33-5.49 (2H, m), 5.98(1H, d,
20 $J=8.4\text{Hz}$), 6.71-6.80(4H, m), 7.28(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3516, 3450,
3431, 1739, 1709, 1639, 1602, 1543, 1506, 1475, 1456, 1284, 1090 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24.5} + 40.2 \pm 0.8^\circ$ ($c=1.011$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{30}\text{H}_{37}\text{NO}_5\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値
(%) : C, 68.34; H, 7.15; N, 2.66; S, 6.08 実測値 (%) : C, 68.35; H, 7.03; N, 2.71;
S, 6.17

- 25 化合物番号 II-226

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.94(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
1.50-2.43(14H, m), 2.31 and 3.70(each 3H, each s), 4.15(2H, s), 4.19(1H, m),

5.33-5.49(2H, m), 5.98(1H, d, J=8.7Hz), 6.77(1H, d, J=3.9Hz), 6.96-7.11(3H, m),
7.31(1H, d, J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2669, 1738, 1709, 1641,
1545, 1506, 1471, 1259, 1011 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 41.2 \pm 0.8^\circ$ (c=1.003, MeOH) 元素
分析 (C₃₀H₃₉NO₄S) 計算値 (%): C, 70.69; H, 7.71; N, 2.75; S, 6.29 実測値 (%):

5 C, 70.41; H, 7.76; N, 2.97; S, 6.04

化合物番号 II-227

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
1.51-2.42(14H, m), 2.16(3H, s), 4.09(2H, s), 4.18(1H, m), 5.32-5.50 (2H, m),
6.01(1H, d, J=8.7Hz), 6.77(1H, d, J=3.6Hz), 7.17 (2H, d, J=8.1Hz), 7.32(1H, d,
10 J=3.6Hz), 7.43(1H, br s), 7.44(2H, d, J=8.1Hz). IR(CHCl₃): 3514, 3435, 3311,
1705, 1639, 1541, 1513, 1410 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24.5} + 40.8 \pm 0.8^\circ$ (c=1.000, MeOH) 元
素分析 (C₃₀H₃₈N₂O₄S · 0.4H₂O) 計算値 (%): C, 68.00; H, 7.38; N, 5.29; S, 6.05
実測値 (%): C, 68.06; H, 7.38; N, 5.28; S, 5.92

化合物番号 II-228

15 ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.94(1H, d, J=9.9Hz), 1.09 and 1.21(each 3H, each s), 1.51-
2.42(14H, m), 2.99(3H, s), 4.11(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m), 6.01(1H,
d, J=9.3Hz), 6.78(1H, d, J=3.6Hz), 6.86 (1H, br s), 7.17-7.25(4H, m), 7.31(1H, d,
J=3.6Hz). IR(CHCl₃): 3510, 3448, 3431, 3371, 1707, 1639, 1543, 1510, 1471,
1456, 1387, 1330, 1155 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24.5} + 37.6 \pm 0.8^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析
20 (C₂₉H₃₈N₂O₅S₂ · 0.3H₂O) 計算値 (%): C, 61.74; H, 6.90; N, 4.97; S, 11.37 実測
値 (%): C, 61.84; H, 6.93; N, 5.03; S, 11.14

化合物番号 II-229

mp.149-150°C ¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.92(1H, d, J=10.5Hz), 1.05 and 1.19(each
3H, each s), 1.47-2.40(14H, m), 4.18(1H, m), 4.40 (2H, s), 5.31-5.46(2H, m),
25 5.98(1H, d, J=8.4Hz), 6.88(1H, d, J=3.9 Hz), 7.30-7.35(2H, m), 7.42-7.48(3H,
m), 7.58(1H, m), 8.08(1H, d, J = 6.6 Hz), 8.14(1H, m). IR(CHCl₃): 3514, 3450,
3431, 2667, 1738, 1707, 1643, 1543, 1508, 1471, 1458, 1444 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24.5} + 39.7$

$\pm 0.8^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($C_{34}H_{37}NO_3S_2$) 計算値 (%) : C, 71.42; H, 6.52; N, 2.45; S, 11.22 実測値 (%) : C, 71.21; H, 6.53; N, 2.51; S, 10.97

化合物番号 II-230

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.92(1H, d, $J=10.5Hz$), 1.06 and 1.19(each 3H, each s),
5 1.48-2.40(14H, m), 3.79(2H, s), 4.18(1H, m), 4.26(2H, s), 5.21-5.47(2H, m),
5.96(1H, d, $J=8.4Hz$), 6.78(1H, d, $J=3.6Hz$), 7.18 (1H, d, $J=7.2Hz$), 7.27-
7.40(4H, m), 7.53(1H, d, $J=7.2Hz$), 7.72(1H, d, $J=7.8Hz$), 7.78(1H, d, $J=6.9Hz$).
IR($CHCl_3$): 3510, 3450, 3431, 2669, 1739, 1709, 1641, 1543, 1506, 1471, 1456
 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+36.6\pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($C_{35}H_{39}NO_3S \cdot 0.2H_2O$)
10 計算値 (%) : C, 75.42; H, 7.13; N, 2.51; S, 5.75 実測値 (%) : C, 75.46; H, 7.15;
N, 2.73; S, 5.55

化合物番号 II-231

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.93(1H, d, $J=9.9Hz$), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-
2.43(14H, m), 2.20, 2.45 and 3.67(each 3H, each s), 4.13 (2H, s), 4.19(1H, m),
15 5.33-5.49(2H, m), 5.97(1H, d, $J=8.4Hz$), 6.77 (1H, td, $J=0.9$ and $3.9Hz$), 6.89
and 6.95(each 1H, each d, each $J=7.8Hz$), 7.31(1H, d, $J=3.6Hz$). IR($CHCl_3$):
3516, 3450, 3431, 1738, 1709, 1641, 1545, 1506, 1458, 1263, 1084, 1009 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24}+39.8\pm 0.8^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析 ($C_{31}H_{41}NO_4S$) 計算値 (%) : C,
71.09; H, 7.89; N, 2.67; S, 6.12 実測値 (%) : C, 70.80; H, 8.02; N, 2.92; S, 6.06

20 化合物番号 II-232

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.93(1H, d, $J=10.2Hz$), 1.06 and 1.19(each 3H, each s),
1.49-2.41(14H, m), 4.18(1H, m), 4.50(2H, s), 5.32-5.47(2H, m), 5.98(1H, d,
 $J=9.0Hz$), 6.89(1H, d, $J=3.9Hz$), 7.29-7.38(4H, m), 7.47 (1H, m), 7.59(1H, d,
 $J=8.4Hz$), 7.86(1H, m), 7.95(1H, d, $J=7.8Hz$). IR($CHCl_3$): 3510, 3450, 3431,
25 2669, 1739, 1709, 1641, 1545, 1508, 1471, 1450, 1423 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24}+40.3\pm 0.8^\circ$
($c=1.007$, MeOH) 元素分析 ($C_{34}H_{37}NO_4S \cdot 0.2H_2O$) 計算値 (%) : C, 73.01; H,
6.74; N, 2.50; S, 5.73 実測値 (%) : C, 72.91; H, 6.58; N, 2.59; S, 5.75

化合物番号 II-233

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.92(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.20(each 3H, each s), 1.50-2.43(14H, m), 4.04(2H, s), 4.20(1H, m), 5.32-5.49(2H, m), 6.03(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.75(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.80 and 7.06(each 2H, each d, $J=8.7\text{Hz}$),
5 7.32(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3446, 3510, 3182, 2673, 1709, 1635, 1614, 1545, 1512, 1471, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+43.8\pm 0.8^\circ$ ($c=1.000$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_4\text{S}$) 計算値 (%) : C, 69.82; H, 7.32; N, 2.91; S, 6.66 実測値 (%) : C, 69.57; H, 7.43; N, 3.00; S, 6.61

化合物番号 II-295

10 mp.156-157°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.00(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.17 and 1.25 (each 3H, each s), 1.57-2.51(14H, m), 4.31(1H, m), 5.34-5.54(2H, m), 6.37(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 7.33-7.47(3H, m), 7.61(1H, s), 7.64(1H, m), 7.70-7.73 (2H, m), 7.87(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 8.15(1H, d, $J=1.2\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3518, 3452, 1741, 1709, 1649, 1510 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23}+67.2\pm 2.1^\circ$ ($c=0.503$, MeOH) 元素分析
15 ($\text{C}_{31}\text{H}_{35}\text{NO}_3\text{S} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 73.95; H, 7.05; N, 2.78; S, 6.37 実測値 (%) : C, 73.94; H, 7.08; N, 3.04; S, 6.53

化合物番号 II-296

mp.126-127°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.20(each 3H, each s), 1.50-2.46(14H, m), 4.17(1H, m), 5.33-5.51(2H, m), 6.04(1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.51(1H, dd, $J=1.5$ and 3.3Hz), 7.13(1H, dd, $J=2.7$ and 3.3Hz),
20 7.22(1H, dd, $J=7.8$ and 9.0Hz), 7.73(1H, dd, $J=1.5$ and 2.1Hz), 7.91-7.96(2H, m). IR(CHCl_3): 3513, 3449, 3144, 1733, 1709, 1651, 1592, 1507, 1496, 1385, 1181 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+36.2\pm 0.8^\circ$ ($c=1.005$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{38}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%) : C, 62.77; H, 6.44; N, 5.42; F, 3.68; S, 6.21 実測値 (%) : C, 62.71; H,
25 6.49; N, 5.39; F, 3.69; S, 6.21

化合物番号 II-297

mp.145-146°C $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.08 and 1.20(each

3H, each s), 1.50-2.45(14H, m), 3.86(3H, s), 4.17(1H, m), 5.33-5.51 (2H, m),
 6.04(1H, d, J=8.4Hz), 6.48(1H, dd, J=1.5 and 3.3Hz), 6.98 and 7.85(each 2H,
 each d, each J=9.0Hz), 7.12(1H, dd, J=2.7 and 3.3Hz), 7.71(1H, dd, J=1.8 and
 2.1Hz). IR(CHCl₃): 3513, 3449, 3413, 3143, 1733, 1709, 1649, 1596, 1576, 1499,
 5 1379, 1266, 1189, 1167 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 34.5 \pm 0.7^\circ$ (c=1.005, MeOH) 元素分析
 (C₂₈H₃₆N₂O₆S) 計算値 (%) : C, 63.61; H, 6.86; N, 5.30; S, 6.07 実測値 (%) : C,
 63.54; H, 6.93; N, 5.18; S, 6.08

化合物番号 II-298

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.97(1H, d, J=10.5Hz), 1.12 and 1.23(each 3H, each s),
 10 1.50-2.50(14H, m), 4.23(1H, m), 5.39-5.51(2H, m), 6.09(1H, d, J=9.6Hz),
 6.35(1H, dd, J=2.4 and 3.9Hz), 6.48(1H, dd, J=2.4 and 3.9Hz), 7.02(1H, dd,
 J=3.6 and 4.8Hz), 7.18(1H, dd, J=0.6 and 4.8 Hz), 7.41(1H, dd, J=0.6 and
 3.6Hz), 10.92(1H, brs). IR(CHCl₃): 3506, 3447, 3220, 3164, 1704, 1617, 1537,
 1508 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 50.7 \pm 0.9^\circ$ (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₃₂N₂O₅S ·
 15 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 67.59; H, 7.35; N, 6.31; S, 7.22 実測値 (%) : C, 67.60;
 H, 7.23; N, 6.39; S, 7.34

化合物番号 II-299

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=10.2Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s),
 1.50-2.44(14H, m), 2.27(3H, s), 4.05(2H, s), 4.20(1H, m), 5.33-5.49(2H, m),
 20 6.01(1H, d, J=8.7Hz), 6.71(1H, d, J=3.9Hz), 7.09 (1H, dd, J=1.2 and 7.8Hz),
 7.17-7.32(3H, m), 7.28(1H, d, J=3.9 Hz). IR(CHCl₃): 3516, 3450, 3431, 2669,
 1747, 1709, 1641, 1543, 1506, 1456, 1369 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{24} + 40.2^\circ \pm 0.8^\circ$ (c=1.006,
 MeOH) 元素分析 (C₃₀H₃₇NO₅S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 68.34; H, 7.15; N, 2.66;
 S, 6.08 実測値 (%) : C, 68.33; H, 6.94; N, 2.83; S, 6.31

25 化合物番号 II-300

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 0.93(1H, d, J=9.9Hz), 1.08 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-
 2.41(14H, m), 2.60(3H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.48(2H, m), 6.18(1H, d, J=8.7Hz),

7.28(1H, d-like), 7.36(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.40 (1H, t-like), 7.51(1H, dt, $J=1.2$ and 7.2Hz), 7.61(1H, d, $J = 3.9 \text{ Hz}$), 8.15(1H, dd, $J=1.2$ and 8.1Hz). IR(CHCl_3): 3512, 3446, 1739, 1709, 1655, 1529, 1504, 1325, 1157 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+51.1 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値(%): C, 63.49; H, 6.66; N, 2.64; S, 12.11 実測値 (%) : C, 63.23; H, 6.53; N, 2.70; S, 12.17

化合物番号 II-301

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.93(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.21(each 3H, each s), 1.50-2.40(14H, m), 2.42(3H, s), 4.20(1H, m), 5.34-5.47(2H, m), 6.17(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.32(1H, d-like), 7.34 and 7.57(each 1H, each d, each $J=4.2\text{Hz}$), 7.86(2H, d-like). IR(CHCl_3): 3512, 3446, 1741, 1707, 1655, 1529, 1504, 1331, 1153 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+54.9 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{35}\text{NO}_5\text{S}_2$) 計算値 (%) : C, 63.49; H, 6.66; N, 2.64; S, 12.11 実測値 (%) : C, 63.16; H, 6.54; N, 2.70; S, 12.16

化合物番号 II-302

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.96(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.14 and 1.25(each 3H, each s), 1.53-2.47(14H, m), 4.25(1H, m), 5.37-5.52(2H, m), 6.23(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.16-7.22(2H, m), 7.36(1H, m), 7.46(1H, s), 7.45-7.49(1H, m). IR(CHCl_3): 3516, 3446, 3429, 1734, 1703, 1652, 1606, 1521, 1496, 1457, 1419 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{25}+72.8^\circ \pm 1.1^\circ$ ($c=1.005$, MeOH), 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 69.63; H, 6.59; N, 2.90; S, 6.63 実測値 (%) : C, 69.51; H, 6.72; N, 3.30; S, 6.56

化合物番号 III-1

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 0.88(1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 1.07 and 1.23(each 3H, each s), 1.56-2.51(13H, m), 2.67(1H, m), 4.41(1H, m), 5.29-5.41(2H, m), 6.07(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 6.34 and 7.16(each 2H, each t, each $J=2.1 \text{ Hz}$), 7.35 and 7.52(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR (CHCl_3): 3511, 3431, 3144, 3101, 2668, 1708, 1656, 1530, 1505, 1455, 1384, 1167 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24}+34.2 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.007$, MeOH) 元素分

析 ($C_{25}H_{32}N_2O_5S_2 \cdot 0.5H_2O$) 計算値 (%) : C, 58.46; H, 6.48; N, 5.45; S, 12.48 実
測値 (%) : C, 58.77; H, 6.40; N, 5.65; S, 12.72

化合物番号 III-47

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.94(1H, d, $J=9.9Hz$), 1.07 and 1.23(each 3H, each s), 1.56-
5 2.48(13H, m), 2.68(1H, m), 4.42(1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.16(1H, d, $J=8.4Hz$),
7.16(1H, dd, $J=3.9$ and $5.1Hz$), 7.42 and 7.63(each 1H, each d, each $J=3.9Hz$),
7.70(1H, dd, $J=1.5$ and $5.1 Hz$), 7.76(1H, dd, $J=1.5$ and $3.9Hz$). IR($CHCl_3$): 3516,
3431, 3365, 3097, 1708, 1654, 1530, 1505, 1402, 1336, 1153 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} +34.5$
 $\pm 0.7^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($C_{25}H_{31}NO_5S_3 \cdot 0.1H_2O$) 計算値 (%) : C,
10 57.36; H, 6.01; N, 2.68; S, 18.38 実測値 (%) : C, 57.16; H, 5.88; N, 2.76; S, 18.36
化合物番号 III-55

1H -NMR ($CDCl_3$) δ : 0.88(1H, d, $J=9.9Hz$), 1.07 and 1.23(each 3H, each s),
1.58-2.34(12H, m), 2.39(3H, s), 2.44(1H, m), 2.68(1H, m), 4.41(1H, m), 5.29-
5.42(2H, m), 5.99(1H, m), 6.08(1H, d, $J=8.4Hz$), 6.20(1H, t, $J=3.3Hz$), 7.19(1H,
15 m), 7.38 and 7.55(each 1H, each d, each $J=3.9Hz$). IR($CHCl_3$): 3510, 3431, 3150,
3100, 1708, 1656, 1530, 1505, 1375, 1161 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{24} +30.9 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.000$,
MeOH) 元素分析 ($C_{26}H_{34}N_2O_5S_2 \cdot 0.3H_2O$) 計算値 (%) : C, 59.58; H, 6.65; N,
5.35; S, 12.24 実測値 (%) : C, 59.57; H, 6.48; N, 5.51; S, 12.22

化合物番号 III-80

1H -NMR($CDCl_3$) δ : 0.90(1H, d, $J=9.9Hz$), 1.06 and 1.23(each 3H, each s), 1.58-
2.48(13H, m), 2.67(1H, m), 4.41(1H, m), 5.29-5.42(2H, m), 6.27(1H, d, $J=8.1Hz$),
7.38-7.44(3H, m), 6.34(1H, d, $J=3.9Hz$), 8.14(1H, dd, $J=1.5$ and $3.0Hz$).
IR($CHCl_3$): 3517, 3431, 3361, 3114, 1708, 1654, 1530, 1504, 1332, 1151 cm^{-1} .
 $[\alpha]_D^{24} +33.7 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.003$, MeOH) 元素分析 ($C_{25}H_{31}NO_5S_3 \cdot 0.2H_2O$) 計算値
25 (%) : C, 57.16; H, 6.02; N, 2.67; S, 18.31 実測値 (%) : C, 57.09; H, 5.88; N,
2.76; S, 18.15

化合物番号 IV-1

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.84 and 1.22(each 3H, each s), 1.43(1H, d, $J=10.5$ Hz),
 1.53-2.50(14H, m), 4.09(1H, m), 5.30-5.41(2H, m), 6.17 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.33
 and 7.16(each 2H, each t-like), 7.40 and 7.57 (each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$).
 IR(CHCl_3): 3514, 3432, 3144, 3102, 1708, 1657, 1531, 1506, 1456, 1384, 1167
 5 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} - 45.4 \pm 0.9^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$)
 計算値 (%): C, 59.10; H, 6.07; N, 5.51; S, 12.62 実測値 (%): C, 59.12; H, 5.83;
 N, 5.53; S, 12.41

化合物番号 IV-47

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 0.85 and 1.22(each 3H, each s), 1.44(1H, d, $J=10.2$ Hz),
 10 1.54-2.51(14H, m), 4.10(1H, m), 5.31-5.41(2H, m), 6.21 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$),
 7.11(1H, dd, $J=3.9$ and 4.8Hz), 7.44 and 7.63 (each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$),
 7.70(1H, dd, $J=1.2$ and 4.8Hz), 7.75 (1H, dd, $J=1.2$ and 3.9Hz). IR(CHCl_3): 3517,
 3423, 3366, 3097, 2665, 1708, 1655, 1530, 1505, 1335, 1153 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} - 46.4$
 $\pm 0.9^\circ$ ($c=1.010$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C,
 15 56.97; H, 6.04; N, 2.66; S, 18.25 実測値 (%): C, 57.10; H, 5.96; N, 2.70; S, 18.02
 化合物番号 V-88

mp.105-106°C; $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 1.06(1H, m), 1.19-1.29(2H, m), 1.42-1.47(2H,
 m), 1.58-1.78(4H, m), 2.00-2.19(5H, m), 2.35(2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.52(1H, m),
 3.82(1H, m), 4.16(2H, s), 5.30-5.42(2H, m), 5.99(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 6.79(1H, dt,
 20 $J=0.9$ and 3.9Hz), 6.96(1H, dd, $J=1.5$ and 4.8Hz), 7.05(1H, m), 7.28(1H, dd,
 $J=3.0$ and 4.8Hz), 7.37(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(KBr): 3367, 2667, 1700, 1612, 1543,
 1520, 1317, 1244 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +70.2 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.006$, MeOH) 元素分析
 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_8\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 64.98; H, 6.59; N, 3.16; S, 14.46 実測値 (%):
 C, 64.92; H, 6.52; N, 3.32; S, 14.48

25

化合物番号 VI-1

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$: 1.24-2.13(13H, m), 2.22(1H, m), 2.32(2H, t, $J=7.2$ Hz),

3.41(1H, m), 3.44(1H, m), 5.18-5.36(2H, m), 6.19(1H, m), 6.33 and 7.15(each 2H, each t, each J=2.4Hz), 7.28 and 7.55(each 2H, each t, each J=3.9Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3439, 3144, 3100, 1708, 1658, 1535, 1508, 1446, 1167 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{28} +69.5 \pm 1.1^\circ$ (c=1.012, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₈N₂O₅S · 0.5H₂O) 計算値 (%) : C, 56.89; H, 6.02; N, 5.77; S, 13.21 実測値 (%) : C, 56.91; H, 5.96; N, 5.91; S, 13.37

化合物番号 VI-31

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.18-2.10(13H, m), 2.11(1H, m), 2.21-2.35(2H, m), 3.35(1H, m), 3.46(1H, m), 4.12(2H, s), 5.17-5.34(2H, m), 5.88(1H, m), 6.74(1H, d, J=3.9Hz), 7.21-7.38(6H, m). IR(CHCl₃): 3511, 3432, 3065, 1708, 1642, 1547, 1515, 1455 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{23} +69.1 \pm 1.1^\circ$ (c=1.009, MeOH) 元素分析 (C₂₆H₃₁NO₃S · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 71.07; H, 7.16; N, 3.19; S, 7.30 実測値 (%) : C, 70.91; H, 7.18; N, 3.19; S, 7.34

化合物番号 VI-40

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.18-2.15(14H, m), 2.24-2.34(2H, m), 3.36(1H, m), 3.58(1H, m), 5.19-5.40(2H, m), 6.07(1H, m), 7.28-7.42(3H, m), 7.51(1H, d, J=0.6Hz), 7.56-7.59(2H, m), 7.72(1H, d, J=0.6Hz). IR (CHCl₃): 3514, 3446, 1709, 1649, 1550, 1520, 1491 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{22} +79.4 \pm 1.2^\circ$ (c=1.004, MeOH) 元素分析 (C₂₅H₂₉NO₃S · 0.2H₂O) 計算値 (%) : C, 70.29; H, 6.94; N, 3.28; S, 7.51 実測値 (%) : C, 70.26; H, 6.68; N, 3.48; S, 7.44

化合物番号 VI-47

¹H-NMR(CDCl₃) δ : 1.14-2.16(13H, m), 2.23(1H, m), 2.30-2.37(2H, m), 3.41(1H, m), 3.45(1H, m), 5.18-5.36(2H, m), 6.19(1H, m), 7.11 (1H, dd, J=3.9 and 5.1Hz), 7.32 and 7.62(each 1H, each d, each J=3.9Hz), 7.39(1H, dd, J=1.5 and 5.1Hz), 7.75(1H, dd, J=1.5 and 3.9Hz). IR(CHCl₃): 3512, 3440, 3096, 1708, 1657, 1534, 1507, 1402, 1336, 1153 cm⁻¹. $[\alpha]_D^{25} +69.2 \pm 1.1^\circ$ (c=1.006, MeOH) 元素分析 (C₂₃H₂₇NO₅S₃ · 0.1H₂O) 計算値 (%) : C, 55.57; H, 5.51; N, 2.83; S, 19.42 実測

値 (%) : C, 55.55; H, 5.32; N, 2.85; S, 19.21

化合物番号 VI-55

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.18-2.18(13H, m), 2.23(1H, m), 2.31-2.35 (2H, m), 2.38(3H, s), 3.43(2H, m), 5.18-5.36(2H, m), 5.98(1H, m), 6.14(1H, m), 6.19(1H, t, $J=3.3\text{Hz}$), 7.17(1H, m), 7.29 and 7.53(each 1H, each d, each $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512 3440, 3150, 3101, 1708, 1658, 1535, 1508, 1375, 1161 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +30.9 \pm 0.7^\circ$ (c=1.000, MeOH)

元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 59.58; H, 6.65; N, 5.35; S, 12.24 実測値 (%) : C, 59.57; H, 6.48; N, 5.51; S, 12.22

10 化合物番号 VI-80

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.16-2.14(13H, m), 2.23(1H, m), 2.28-2.36(2H, m), 3.54-3.46(2H, m), 5.17-5.37(2H, m), 6.14(1H, m), 7.32(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.38-7.44(2H, m), 7.61(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 8.15(1H, dd, $J=1.2$ and 3.0Hz). IR(CHCl_3): 3508, 3431, 3114, 1708, 1656, 1534, 1508, 1331, 1152, 1102 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +66.5 \pm 1.1^\circ$

15 (c=1.003, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{27}\text{NO}_5\text{S}_3 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 55.35; H, 5.57; N, 2.81; S, 19.28 実測値 (%) : C, 55.29; H, 5.54; N, 2.85; S, 19.01

化合物番号 VI-104

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.18-2.14(13H, m), 2.25(1H, m), 2.31-2.39(2H, m), 3.32(1H, m), 3.56(1H, m), 4.09(2H, d, $J=0.3\text{Hz}$), 5.18-5.38(2H, m), 5.89(1H, m), 6.68(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 6.94(1H, dd, $J=3.6$ and 5.1Hz), 7.02(1H, dd, $J=1.5$ and 3.6Hz), 7.23(1H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.35(1H, dd, $J=1.5$ and 5.1Hz). IR(CHCl_3): 3514, 3433, 1709, 1645, 1545, 1516, 1458 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +61.8 \pm 1.0^\circ$ (c=1.008, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_3\text{S}_3 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 60.14; H, 6.18; N, 2.92; S, 20.07 実測値 (%) : C, 60.08; H, 6.11; N, 2.90; S, 20.05

25 化合物番号 VI-122

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06-2.15(13H, m), 2.27(1H, m), 2.28-2.38(2H, m), 3.31(1H, m), 3.54(1H, m), 4.24(2H, d, $J=0.6\text{Hz}$), 5.17-5.36(2H, m), 5.87(1H, m), 6.78(1H,

d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.21-7.42(6H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3433, 3062, 2669, 1709, 1643, 1545, 1514 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22} +64.3 \pm 1.0^\circ$ ($c=1.000$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_3\text{S}_2 \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 65.24; H, 6.74; N, 2.93; S, 13.40 実測値 (%) : C, 65.23; H, 6.55; N, 3.00; S, 13.46

5 化合物番号 VI-123

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06-2.15(13H, m), 2.23(1H, m), 2.28-2.38(2H, m), 3.35(1H, m), 3.54(1H, m), 5.20(2H, s), 5.19-5.37(2H, m), 5.95(1H, m), 6.94-7.04(4H, m), 7.27-7.35(3H, m). IR(CHCl_3): 3514, 3433, 1709, 1647, 1599, 1547, 1518, 1495 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +67.8 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.008$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{31}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 68.30; H, 6.92; N, 3.06; S, 7.01 実測値 (%) : C, 68.31; H, 6.84; N, 3.16; S, 7.11

化合物番号 VI-124

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.06-2.14(13H, m), 2.24(1H, m), 2.30-2.37(2H, m), 3.31(1H, m), 3.53(1H, m), 4.50(2H, d, $J=0.9\text{Hz}$), 5.15-5.36(2H, m), 5.89(1H, m), 6.65-6.79(3H, m), 6.95(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$), 7.15-7.21 (2H, m), 7.33(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3512, 3440, 1707, 1643, 1603, 1547, 1506 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{22} +67.3 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_3\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 68.18; H, 7.17; N, 6.20; S, 7.00 実測値 (%) : C, 68.04; H, 7.09; N, 6.25; S, 7.02

化合物番号 VI-133

20 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.18-1.81(7H, m), 1.85-1.94(2H, m), 2.01-2.13 (2H, m), 2.22-2.33(3H, m), 3.41(1H, m), 3.33(1H, m), 3.49(2H, s), 3.54 (1H, m), 4.15(2H, s), 5.17-5.37(2H, m), 5.90(1H, m), 6.12(1H, dd, $J=0.9$ and 3.0Hz), 6.31(1H, dd, $J=1.8$ and 3.0Hz), 6.81 and 7.30 (each 1H, each d, each $J=3.6\text{Hz}$), 7.34(1H, dd, $J=0.9$ and 1.8Hz). IR(CHCl_3): 3516, 3433, 1709, 1643, 1547, 1516 cm^{-1} . $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +71.3 \pm 1.1^\circ$ ($c=1.004$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{29}\text{NO}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%) : C, 66.58; H, 6.89; N, 3.24; S, 7.41 実測値 (%) : C, 66.55; H, 6.63; N, 3.37; S, 7.51

化合物番号 VI-303

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$: 1.18-2.14(13H, m), 2.26(1H, m), 2.31-2.36(2H, m), 3.30(1H, m), 3.64(1H, m), 3.82(3H, s), 5.19-5.39(2H, m), 6.06(1H, m), 6.89-7.01(6H, m), 7.66(2H, d, $J=8.1\text{Hz}$). IR(CHCl_3): 3514, 3446, 1709, 1649, 1550, 1520, 1491 cm^{-1} . $[\alpha]_D^{22} +76.3 \pm 1.2^\circ$ ($c=1.009$, MeOH) 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{NO}_6 \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値
5 (%) : C, 71.99; H, 7.21; N, 3.00 実測値 (%) : C, 72.05; H, 7.35; N, 2.93

上記実施例および参考例で得た化合物につき、以下の試験例に示す方法で、インビボおよびインビトロ活性を試験した。

試験例 1 PGD₂受容体の結合実験

10 (1) ヒト血小板膜画分の調製

健康人(成人男性および女性)の静脈より EDTA(終濃度 10mM)の入ったプラスチック製シリンジにて採血した血液をプラスチック製試験管に入れ、軽く転倒混和した後、室温で、1200 rpm、10分間遠心分離し、上清の多血小板血漿[PRP (Platelet rich plasma)]を採取した。この PRP をさらに室温、2300 rpm、22
15 分間の遠心分離に付し、血小板を得た。得られた血小板は homogenizer (Ultra-Turrax) を用いてホモジナイズした後、4℃、20000 rpm、10分間遠心分離を3回行い、血小板膜画分を得た。膜画分は蛋白定量後、2 mg/ml とし、結合実験に供するまで -80℃で冷凍保存した。

(2) PGD₂受容体の結合実験

20 結合反応液(50 mM Tris/HCl, pH 7.4, 10 mM MgCl₂)にヒト血小板膜画分(0.08mg)および 5 nM [^3H] PGD₂ (115 Ci/mmol)を加えて 0.2 ml とし、4℃で 90分間反応させた。反応後ガラス繊維濾紙を用いて濾過し、冷生理食塩水で数回洗浄し、濾紙に残った放射活性を測定した。全結合量から非特異的結合量(10 μM PGD₂存在下で、同様に求めた放射活性量)を差し引くことで、特異的結合量を算出した。各化合物の結合阻害活性は、化合物非存在
25 下での特異的結合量を 100%とし、各化合物存在下での特異的結合量(%)を求めて置換曲線を作成することにより、50%抑制濃度(IC₅₀値)を算出した。

試験例 2 TXA₂受容体の結合実験

(1) ヒト血小板膜画分の調製

試験例 1 (1) に記載の手法に従って、ヒト血小板膜画分を調製した。

5 (2) TXA₂受容体の結合試験

結合反応液 (50 mM Tris/HCl, pH 7.4, 10 mM MgCl₂) にヒト血小板膜画分 (0.08mg) および 2 nM [³H] (+) - (5Z) - 7 - [3-エンドー
[(フェニルスルホニル) アミノ] ビシクロ [2.2.1] ヘプト-2-エキソ
-イル] ヘブテン酸ナトリウム塩 (特公平 5-79060、以下 (+) - S-1
10 45 ナトリウム塩という) 26.4 Ci/mmol を加えて 0.2 ml とし、室温で 90 分
間反応させた。反応後ガラス繊維濾紙を用いて濾過し、冷生理食塩水で数回洗浄
し、濾紙に残った放射活性を測定した。全結合量から非特異的結合量 (10 μM
(+) - S-145 ナトリウム塩存在下で、同様に求めた放射活性量) を差
し引くことで、特異的結合量を算出した。各化合物の結合阻害活性は、化合物非
15 存在下での特異的結合量を 100% とし、各化合物存在下での特異的結合量 (%)
を求めて置換曲線を作成することにより、50% 抑制濃度 (IC₅₀ 値) を算出し
た。

試験例 3 ヒト血小板を使った PGD₂ 受容体の拮抗活性

20 あらかじめ 1/9 量のクエン酸-デキストロース液を添加したシリンジで健常
人から末梢血を採取し、室温で 1200 rpm、10 分間遠心した後、上清 (P
R P : platelet rich plasma) を採取した。得られた P R P を洗浄バッファーで
3 回遠心洗浄した後、血小板数をマイクロセルカウンターでカウントした。最終濃
度 5 × 10⁸ 個/ml となるように PBS で調製した血小板浮遊液を 37 °C に加温後、
25 3-イソブチル-1-メチルキサンチン (0.5 mM) で 5 分間前処置し、種々の
濃度に希釈した化合物を添加し、その 10 分後に終濃度 0.1 μM の PGD₂ を添
加して反応を惹起した。2 分後に塩酸を加えて反応を停止し、超音波ホモジナイ

ザーにて血小板を破壊し、遠心後その上清中の cAMP 量を放射性免疫測定法にて定量した。薬物の PGD_2 受容体拮抗活性は PGD_2 添加によって増加した cAMP 量に対する抑制率を各濃度で求め、50%の抑制を示す薬物濃度を算出して評価した。

- 5 試験例 1～3 の結果を以下に示す。表 68 および 69 は実施例化合物の試験結果を表わし、表 70 および表 71 は参考例化合物の試験結果を表わす。

表 6 8

化合物番号	PGD ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	TXA ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	PGD ₂ ヒト血小板 cAMP 上昇阻害 IC ₅₀ (μ M)
I-5A-59a		0.011	0.079
I-7A-1a	0.0076	0.0046	0.035
I-7A-31a		0.063	0.057
I-7A-47a	0.073	0.003	0.018
I-7A-59a		0.0098	0.012
I-7A-88a		0.034	0.036
I-7A-104a		0.024	0.082
I-7A-143a		0.084	0.036
I-7I-1a		0.0026	0.064
I-7I-31a		0.065	0.092
I-7I-47a		0.0012	0.085
I-7I-88a		0.033	0.025
I-7I-126a		0.061	0.021
I-7I-270a		0.0009	0.026
I-7I-307a		0.051	0.097
I-7M-1e		0.044	0.039
I-7M-59a		0.040	0.024
I-7M-143a		0.021	0.026
I-7M-270a		0.0014	0.012
I-7M-307a		0.100	0.024
I-7M-315a		0.039	0.028
I-7M-316a		0.062	0.11
I-7M-317a		0.074	0.018
I-7M-318a		0.068	0.028
I-7M-333a		0.013	0.094
I-7M-337a		0.037	0.019
I-7M-343a		0.029	0.033
I-7M-393a		0.019	0.11
I-7M-424a		0.0076	0.02
I-7M-446a		0.0063	0.027
I-7P-1a		0.034	0.036
I-7R-1a		0.01	0.018
I-7R-270a		0.012	0.027

表 6 9

化合物番号	PGD ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	TXA ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	PGD ₂ ヒト血小板 cAMP 上昇阻害 IC ₅₀ (μ M)
II-5A-1a	0.027	0.0012	0.066
II-5A-31a		0.013	0.045
II-5A-55a	0.0053	0.0006	0.017
II-5A-88a		0.022	0.019
II-5A-104a		0.013	0.047
II-5A-143a		0.047	0.024
II-5B-55a	0.0042	0.0012	0.011
II-5F-55a		0.0019	0.061
II-6A-55a	0.047	0.026	0.1
II-7A-31a		0.082	0.027
II-7A-47a		0.0038	0.059
II-7A-55a	0.0062	0.0042	0.057
II-7A-55e		0.019	0.19
II-7A-59a		0.040	0.042
II-7A-143a		0.037	0.019
II-7I-55a	0.0018	0.0023	0.063
II-7I-59a		0.015	0.015
II-7I-126a		0.102	0.013
II-7I-239a		0.046	0.042
II-7I-270a		0.0006	0.032
II-7I-343a		0.0041	0.079
II-7M-1a		0.0012	0.054
II-7M-1e		0.011	0.12
II-7M-1k		0.020	0.02
II-7M-31a		0.047	0.033
II-7M-47a	0.024	0.0018	0.073
II-7M-55a	0.0013	0.0022	0.013
II-7M-59a		0.027	0.021
II-7M-88a		0.122	0.014
II-7M-126a		0.119	0.026
II-7M-197a		0.012	0.019
II-7M-239a		0.055	0.028
II-7M-270a		0.0006	0.034
II-7M-307a		0.077	0.021
II-7M-332a		0.0017	0.067
II-7M-343a		0.0045	0.075
II-7N-55a	0.0065	0.0025	0.02
II-7P-55a		0.0084	0.047
II-7R-55a		0.0036	0.013
II-7R-270a		0.015	0.023
II-7U-55a		0.021	0.077

表 7 0

化合物番号	PGD ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	TXA ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	PGD ₂ ヒト血小板 cAMP 上昇阻害 IC ₅₀ (μ M)
I-1	0.0043	0.003	0.0013
I-10	0.0016	0.092	0.0018
I-31	0.0082	0.130	0.0057
I-47	0.0041	0.0062	0.007
I-59	0.00041	0.016	0.0046
I-66	0.0046	0.034	0.044
I-79	0.00042	0.015	0.024
I-80	0.0066	0.0052	0.039
I-82	0.032	0.0018	0.053
I-88	0.0076	0.078	0.0047
I-93	0.0070	0.072	0.0084
I-94	0.001	0.083	0.01
I-104	0.0001	0.039	0.0016
I-106	0.013	0.013	0.0093
I-117	0.0091	0.0038	0.047
I-128	0.020	0.048	0.01
I-129	0.011	0.052	0.022
I-131	0.044	0.019	0.041
I-132	0.032	0.012	0.043
I-136	0.023	0.016	0.015
I-143	0.0027	0.028	0.0019
I-146	0.044	0.019	0.073
I-160	0.028	0.02	0.085
I-168	0.00046	0.034	0.029
I-169	0.00061	0.032	0.026
I-170	0.00092	0.027	0.017
I-182	0.061	0.028	0.011

表 7 1

化合物番号	PGD ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	TXA ₂ ヒト血小板 膜面分結合活性 IC ₅₀ (μ M)	PGD ₂ ヒト血小板 cAMP 上昇阻害 IC ₅₀ (μ M)
II-1	0.002	0.012	0.011
II-18	0.0079	0.030	0.0003
II-37	0.026	0.0043	0.035
II-47	0.00096	0.0036	0.004
II-55	0.0015	0.0044	0.0039
II-59	0.0001	0.014	0.024
II-101	0.072	0.0040	0.045
II-117	0.022	0.0026	0.024
II-126	0.0046	0.045	0.004
II-138	0.032	0.072	0.025

試験例 4 ラットにおける血漿中濃度推移

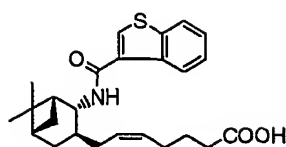
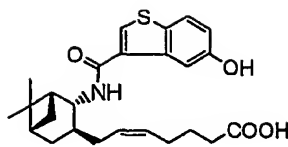
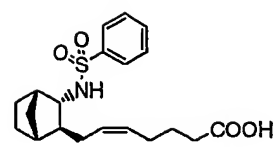
Jcl-SD 系雄性ラットに化合物 (0.5–2 mg/kg) を静脈内投与した。投与 2、
5 5、15、30、60、120、180、240 分後の未変化体濃度を、HPLC (定量限界 ; 0.05 μ g/ml) あるいは LC/MS/MS (定量限界 ; 0.001 μ g/ml) を用いて測定し、消失半減期を算出した。

表 7 2

化合物番号	消失半減期 (分)
参考化合物 I-1	9.4
I-7M-1a	26.3
参考化合物 I-143	4.7
I-7M-143a	33.4
参考化合物 II-59	11.0
II-7I-59a	67.0
II-7M-59a	92.6

本発明化合物は参考化合物に比べ約 3 から 8 倍の消失半減期の延長が見られ、
10 代謝的に安定であることが示されている。

以下に、PGD₂/TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する本発明化合物 (例えば、II-7I-55a、II-7M-55a) と、PGD₂ 受容体拮抗剤 (例えば、B-1、B-2)、TXA₂ 受容体拮抗剤 (例えば、A) との比較試験例を示す。

PGD₂受容体拮抗剤 (B-1)PGD₂受容体拮抗剤 (B-2)TXA₂受容体拮抗剤 (A)

比較試験例 1

PGD₂/TXA₂両受容体拮抗作用を有する化合物、PGD₂受容体拮抗剤、

- 5 TXA₂受容体拮抗剤の比較を行うため、上記の試験例 1～3 の試験を行った。

表 7 3

化合物	試験例 1	試験例 2	試験例 3
	PGD ₂ 受容体 拮抗活性 IC ₅₀ (μM)	TXA ₂ 受容体 拮抗活性 IC ₅₀ (μM)	PGD ₂ 受容体 拮抗活性 IC ₅₀ (μM)
本発明化合物 (II-7I-55a)	0.0018	0.0023	0.063
本発明化合物 (II-7M-55a)	0.0013	0.0022	0.013
TXA ₂ 受容体拮抗剤 (A)	>10	0.0038	>10
PGD ₂ 受容体拮抗剤 (B-1)	0.022	0.37	0.030

比較試験例 2

抗原誘発気道過敏性亢進

- 10 Hartley 系雄性モルモットに 1% 卵白アルブミン (OVA) のエアロゾルを 1 週間
間隔で 2 回それぞれ 10 分間吸入させることにより能動的に感作した。その 1 週間
後に抗ヒスタミン剤であるジフェンヒドラミン (10 mg/kg, i. p.) 処置下で、
1% OVA のエアロゾルを 5 分間吸入させることにより、抗原チャレンジを行った。
その 24 時間後にベントバルビタール (30 mg/kg, i. p.) 麻酔下で、3.13, 6.25,
15 12.5, 25, 50 および 100 mg/kg のアセチルコリンを低用量より順次 5 分間隔で
静注し、直後に生じる気道抵抗の増大を Konzett-Rössler の変法により測定し、
アセチルコリンの用量反応曲線を作成した。この用量反応曲線より、気道抵抗が
ベースラインの 200%に増大するのに必要なアセチルコリンの用量 (PD₂₀₀) を算

出し、この値を各個体の気道反応性とした。化合物はいずれも抗原チャレンジの 1 時間前に経口投与した。以下の表に結果を示す。** : $P < 0.01$ vs Vehicle (Dunnett's test) , ** : $P < 0.01$ vs Vehicle (Student's t test) .

表 7 4

	Log PD ₂₀₀
Vehicle	1.033 ± 0.053
本発明化合物 (II-7I-55a) 10mg/kg	1.442 ± 0.055 **
本発明化合物 (II-7M-55a) 10mg/kg	1.485 ± 0.119 **
陰性対照群	1.517 ± 0.067 **

5

表 7 5

	Log PD ₂₀₀
Vehicle	1.125 ± 0.023
化合物 (B-2) 10mg/kg	1.237 ± 0.052
陰性対照群	1.465 ± 0.074 **

表 7 6

	Log PD ₂₀₀
Vehicle	1.11 ± 0.06
化合物 (A) 1mg/kg	1.29 ± 0.04
化合物 (A) 10mg/kg	1.61 ± 0.09 **
陰性対照群	1.69 ± 0.06 **

表 7 4 ~ 表 7 6 に示すように、PGD₂ 受容体拮抗剤 (B-2) は、本モデルでの気道過敏亢進に対し抑制作用を示さないが、TXA₂ 受容体拮抗剤 (A) および PGD₂ / TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する化合物 (例えば、II-7I-55a、II-7M-55a) は、顕著な抑制作用を示す。このことは、気道過敏性亢進を改善するためには TXA₂ 受容体拮抗作用が重要であることを示す。

15 比較試験例 3

抗原誘発気管支肺胞洗浄液中炎症性細胞浸潤

抗原誘発気道過敏性亢進測定後、10 mL の生理食塩水で気管支肺胞洗浄を行った。回収した洗浄液中の総細胞数をチュルク染色で計測した。以下の表に結果を示す。* : $P < 0.05$, ** : $P < 0.01$ vs Vehicle (Dunnett's test) , ** : $P < 0.01$ vs

Vehicle (Student's t test) . () : 抑制率.

表 7 7

	総細胞数 (×10 ⁶ 個/animal)
Vehicle	23.36 ± 2.33
本発明化合物 (II-7I-55a) 10mg/kg	12.26 ± 1.54 ** (80%)
本発明化合物 (II-7M-55a) 10mg/kg	18.29 ± 1.46 (36%)
陰性対照群	9.43 ± 0.78 ##

5 表 7 8

	総細胞数 (×10 ⁶ 個/animal)
Vehicle	17.12 ± 2.20
化合物 (B-2) 10mg/kg	9.72 ± 2.32 * (53%)
陰性対照群	3.20 ± 0.52 ##

表 7 9

	総細胞数 (×10 ⁶ 個/animal)
Vehicle	13.89 ± 2.42
化合物 (A) 10mg/kg	15.20 ± 2.20 (-12%)
陰性対照群	2.98 ± 0.28 ##

- 表 7 7 ~ 表 7 9 に示すように、PGD₂ 受容体拮抗剤 (B-2) および PGD₂/TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する化合物 (II-7I-55a、II-7M-55a) は炎症性細胞の浸潤を抑制するが、TXA₂ 受容体拮抗剤 (A) はまったく抑制作用を示さない。このことは、炎症性細胞の浸潤を抑制するためには PGD₂ 受容体拮抗作用が重要であることを示す。

15 比較試験例 4

PGD₂ および U-46619 誘発結膜血管透過性亢進

- Hartley 雄性モルモットの両眼に 0.1% PGD₂ あるいは 0.1% U-46619 (TXA₂ 受容体作動物質) を 10 μl ずつ無麻酔下で点眼することにより反応を惹起し、直ちに色素であるエバンズブルー (20 mg/kg) を静注した。反応惹起 30 分後にベントバルビタール (30 mg/kg, i.p.) 麻酔下でモルモットを放血致死させ、結膜組織を摘出

- した。摘出した組織にホルムアミド 3 ml を加え、60°Cで一昼夜以上インキュベートして色素を抽出した。組織抽出液を遠心後上清の 620 nm における吸光度を測定し、エバンスブルーの検量線から漏出色素量を算出した。化合物はいずれも 0.5%メチルセルロースに懸濁後、反応惹起の 1 時間前に経口投与した。化合物の拮抗
- 5 活性は、PGD₂ あるいは U-46619 によって引き起こされる結膜色素漏出に対する抑制率を各用量で求め、50%の阻害を示す化合物用量 (ED₅₀ 値)を算出して評価した。

表 8 0

化合物	ED ₅₀ (mg/kg)	
	PGD ₂	TXA ₂ (U-46619)
II-7I-55a	0.33	0.030
II-7M-55a	0.043	0.083
PGD ₂ 受容体拮抗剤 (B-2)	0.099	>10
TXA ₂ 受容体拮抗剤 (A)	>30	0.017

- 10 表 8 0 に示すように、PGD₂ 受容体拮抗剤 (B-2) は PGD₂ 刺激による結膜血管透過性亢進を阻害するが、U-46619 刺激による反応は阻害しない。一方、PGD₂ /TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する化合物 (II-7I-55a、II-7M-55a) は、両反応とも顕著な抑制作用を示し、in vivo においても両受容体の阻害が確認できた。

15 製剤例

以下に示す製剤例 1～8 は例示にすぎないものであり、発明の範囲を何ら限定することを意図するものではない。「活性成分」なる用語は、本発明化合物、その互変異性体、それらのプロドラッグ、それらの製薬的に許容される塩、又はそれらの水和物を意味する。

20 (製剤例 1)

硬質ゼラチンカプセルは次の成分を用いて製造する：

用量

(mg / カプセル)

活性成分	2 5 0
デンプン（乾燥）	2 0 0
ステアリン酸マグネシウム	<u>1 0</u>
合計	4 6 0 m g

5 (製剤例 2)

錠剤は下記の成分を用いて製造する：

		用量
		(m g / 錠剤)
	活性成分	2 5 0
10	セルロース（微結晶）	4 0 0
	二酸化ケイ素（ヒューム）	1 0
	ステアリン酸	<u>5</u>
	合計	6 6 5 m g

成分を混合し、圧縮して各重量 6 6 5 m g の錠剤にする。

15 (製剤例 3)

以下の成分を含有するエアロゾル溶液を製造する：

		重量
	活性成分	0 . 2 5
	エタノール	2 5 . 7 5
20	プロベラント 2 2（クロロジフルオロメタン）	<u>7 4 . 0 0</u>
	合計	1 0 0 . 0 0

活性成分とエタノールを混合し、この混合物をプロベラント 2 2 の一部に加え、
- 3 0 °C に冷却し、充填装置に移す。ついで必要量をステンレススチール容器へ
供給し、残りのプロベラントで希釈する。バブルユニットを容器に取り付ける。

25 (製剤例 4)

活性成分 6 0 m g を含む錠剤は次のように製造する：

活性成分	6 0 m g
------	---------

	デンプン	4 5 m g
	微結晶性セルロース	3 5 m g
	ポリビニルピロリドン（水中 1 0 % 溶液）	4 m g
	ナトリウムカルボキシメチルデンプン	4 . 5 m g
5	ステアリン酸マグネシウム	0 . 5 m g
	滑石	<u>1 m g</u>
	合計	1 5 0 m g

活性成分、デンプン、およびセルロースは N o . 4 5 メッシュ U . S . のふるいにかけて、十分に混合する。ポリビニルピロリドンを含む水溶液を得られた粉末と混合し、ついで混合物を N o . 1 4 メッシュ U . S . ふるいに通す。このようにして得た顆粒を 5 0 ° C で乾燥して N o . 1 8 メッシュ U . S . ふるいに通す。あらかじめ N o . 6 0 メッシュ U . S . ふるいに通したナトリウムカルボキシメチルデンプン、ステアリン酸マグネシウム、および滑石をこの顆粒に加え、混合した後、打錠機で圧縮して各重量 1 5 0 m g の錠剤を得る。

15 （製剤例 5）

活性成分 8 0 m g を含むカプセル剤は次のように製造する：

	活性成分	8 0 m g
	デンプン	5 9 m g
	微結晶性セルロース	5 9 m g
20	ステアリン酸マグネシウム	<u>2 m g</u>
	合計	2 0 0 m g

活性成分、デンプン、セルロース、およびステアリン酸マグネシウムを混合し、N o . 4 5 メッシュ U . S . のふるいに通して硬質ゼラチンカプセルに 2 0 0 m g ずつ充填する。

25 （製剤例 6）

活性成分 2 2 5 m g を含む坐剤は次のように製造する：

活性成分	2 2 5 m g
------	-----------

飽和脂肪酸グリセリド

2 0 0 0 m g

合計

2 2 2 5 m g

活性成分を No. 60 メッシュ U. S. のふるいに通し、あらかじめ必要最小限に加熱して融解させた飽和脂肪酸グリセリドに懸濁する。ついでこの混合物を、

5 みかけ 2 g の型に入れて冷却する。

(製剤例 7)

活性成分 50 mg を含む懸濁剤は次のように製造する：

	活性成分	5 0 m g
	ナトリウムカルボキシメチルセルロース	5 0 m g
10	シロップ	1 . 2 5 m l
	安息香酸溶液	0 . 1 0 m l
	香料	q . v .
	色素	q . v .
	精製水を加え合計	5 m l

15 活性成分を No. 45 メッシュ U. S. のふるいにかけて、ナトリウムカルボキシメチルセルロースおよびシロップと混合して滑らかなペーストにする。安息香酸溶液および香料を水の一部で希釈して加え、攪拌する。ついで水を十分量加えて必要な体積にする。

(製剤例 8)

20 静脈用製剤は次のように製造する：

	活性成分	1 0 0 m g
	飽和脂肪酸グリセリド	1 0 0 0 m l

上記成分の溶液は通常、1 分間に 1 m l の速度で患者に静脈内投与される。

25 産業上の利用可能性

以下の表において、従来の TXA₂ 受容体拮抗剤、PGD₂ 受容体拮抗剤、本発明化合物 (I) の薬効を比較する。

表 8 1

	TXA ₂ 受容体拮抗剤	PGD ₂ 受容体拮抗剤	本発明化合物 (I)
気管支喘息			
炎症性細胞浸潤	×	◎	◎
気道過敏性亢進	◎	×	◎
気道収縮	◎	×	◎

気管支喘息においては、TXA₂受容体拮抗剤単独では、気道過敏性亢進、気道収縮を抑制することができるが、炎症性細胞浸潤には無効である。また、PGD₂受容体拮抗剤単独では、炎症性細胞浸潤を抑制することができるが、気道過敏性亢進および気道収縮には無効である。しかし、本発明化合物 (I) のような PGD₂/TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する化合物は、炎症性細胞浸潤、気道過敏性亢進、気道収縮のすべてにおいて有効である。

また、TXA₂受容体拮抗剤は炎症性細胞浸潤には無効であるが、TXA₂受容体拮抗剤が PGD₂受容体拮抗剤の炎症性細胞浸潤抑制効果を増強することを確認した。

すなわち、TXA₂受容体拮抗剤と PGD₂受容体拮抗剤は相乗効果を表わすことを確認した。従って、本発明化合物 (I) のような PGD₂/TXA₂ 両受容体拮抗作用を有する化合物は、特に有用である。

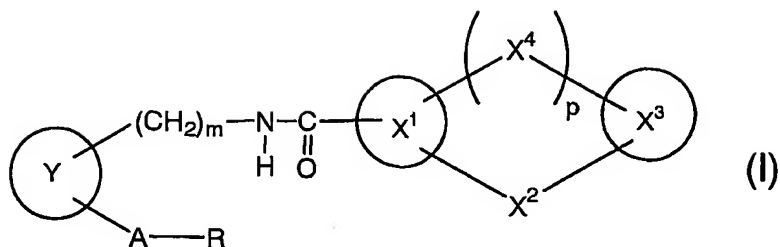
また、TXA₂および PGD₂の両受容体拮抗作用を有する化合物は、全身性肥満細胞症および全身性肥満細胞活性化障害の治療剤、さらには気管支収縮抑制剤、抗喘息剤、アレルギー性鼻炎治療剤、アレルギー性結膜炎治療剤、蕁麻疹治療剤、かゆみの治療剤、アトピー性皮膚炎治療剤、食餌アレルギー治療剤、虚血再灌流障害治療剤、脳血管障害治療剤、抗炎症剤、鼻閉治療剤、抗血栓剤、血管収縮抑制剤、アロデニア等による疼痛の治療剤、マラリア等の感染による昏睡の治療剤等として有用であり、また動脈硬化、心筋梗塞、急性心筋虚血狭心症、循環器系ショック、突然死等の症状の治療、改善にも有効である。特に、抗喘息剤、鼻閉治療剤、アレルギー性結膜炎治療剤、またはアレルギー性鼻炎治療剤、さらには抗喘息剤として有用である。

また、両受容体拮抗作用を有することにより、TXA₂受容体拮抗剤と PGD₂受容体拮抗剤の同時投与（例えば、併用療法、合剤など）によって生じる問題点（例

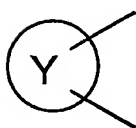
えば、代謝速度の違いから生じる問題点）を回避することができる。

請求の範囲

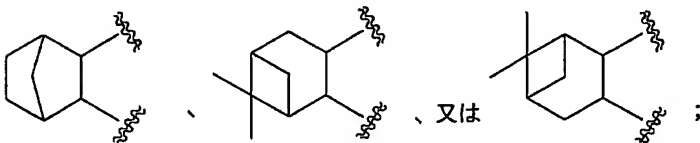
1. 式 (I) :



5 (式中、



は、



10 Aはヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および／または不飽和結合を有していてもよいアルキレン；

Rは $-C(=O)-R^1$ 、 $-CH_2-R^1$ 、またはテトラゾリル；

R^1 はヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノ；

mは0または1；

15 但し、mが1であり、Aが $-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつRが $-C(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合、およびAが $-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-$ であり、かつRが $-C(=O)-R^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合を除く；

pは0または1 (p=0ときは、 X^1 と X^3 は X^4 を介して結合していない)；

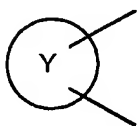
20 X^1 および X^3 はそれぞれ独立して置換されていてもよいアリール、置換されてい

てもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよい非芳香族ヘテロ環式基；

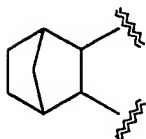
X^2 は単結合、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、
 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3)$
 5 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})$
 $-\text{CH}_2-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}$
 $\text{H}_2-\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SO}_2$
 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}_2)-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{Me})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})-$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$
 $\text{NH}-$ または $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{Me})-$ ；

10 X^4 は $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、
 $-(\text{C}=\text{O})-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{SO}_2-$ 、
 $-\text{SO}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NH}-$ 、または $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ で
ある。

15 但し、

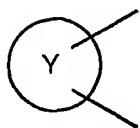


が、

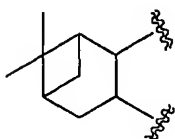


であり、

20 A が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ であり、 m
が1であり、 p が0であり、 X^1 および X^3 がフェニルであり、かつ X^2 が $-\text{N}=\text{N}-$
である場合を除き、



が、



であり、

- 5 X^1 および X^3 がフェニルであり、 X^2 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{O}-$ 、または $-\text{S}-$ であり、 m が 0 であり、かつ p が 0 であるときは、
 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、
 A が $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、
 10 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{COOH}$ である場合、および
 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、 R が $-\text{CH}_2\text{OH}$ である場合を除く。)
- 15 示される化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

2. A がヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および/または不飽和結合を有していてもよいアルキレンであり、 R が $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^1$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^1$ 、またはテトラゾリル
 20 であり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノである（但し、 A が $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、かつ R が $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^1$ (R^1 はヒドロキシまたはアルキルオキシ) である場合、および
 A が $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり、かつ R が $-\text{C}(=\text{O})$

—R¹ (R¹はヒドロキシまたはアルキルオキシ)である場合を除く)である請求の範囲第1項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

3. Aがヘテロ原子が介在している、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および/または不飽和結合を有していてもよいアルキレンである請求の範囲第1項または第2項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

4. Aがヘテロ原子が介在していてもよく、オキシ基を有していてもよく、ハロゲンで置換されていてもよく、および/または不飽和結合を有していてもよい炭素数1～4または7～9のアルキレンである請求の範囲第1項または第2項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

5. Aが—CH₂—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH(F)—、—CH₂—CH=CH—、—CH₂—O—CH₂—、—CH₂—CH=C(F)—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH=CH—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH=CH—、—CH=CH—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH₂—O—CH₂—、—CH₂—CH₂—S—CH₂—、—CH₂—CO—NH—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH=CH—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH=CH—、—CH₂—CH₂—CH₂—O—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—S—CH₂—、—CH₂—CH₂—CO—NH—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH(CH₃)—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—C(CH₃)₂—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH(F)—、—CH₂—CH=CH—CH₂—CH₂—CH(CH₃)—、—CH₂—CH=CH—CH₂—CH₂—C(CH₃)₂—、—CH₂—CH=CH—CH₂—CH₂—CH(F)—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH=CH—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—CH=C(CH₃)—、—CH₂—CH₂—CH₂—CH₂—C(CH₃)=

$\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{F})-\text{CH}_2-$
 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
5 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-\text{CH}_2-$
 $-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$
 CH_2-CH_2- 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}$
10 $\text{H}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、または $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}$
 H_2-CH_2- である請求の範囲第1項または第2項記載の化合物、そのプロドラ
 ッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

6. Aが $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$
 $\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、
 15 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、ま
 たは $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ である請求の範囲第5項記
 載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒
 和物。

7. Aが $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ である請求の範囲第6項
 20 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶
 媒和物。

8. X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアリールまたは置換
 されていてもよいヘテロアリールである請求の範囲第1項～第7項のいずれかに
 記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶
 25 媒和物。

9. X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいヘテロアリールであ
 る請求の範囲第8項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、

またはそれらの溶媒和物。

10. X^1 および X^3 がそれぞれ独立して置換されていてもよいヘテロアリールである請求の範囲第9項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

5 11. X^1 および X^3 の少なくとも一方が置換されていてもよいチエニルまたは置換されていてもよいベンゾチエニルである請求の範囲第9項記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

12. X^2 が単結合、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{S}-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、または $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}-$
10 である請求の範囲第1項～第11項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

13. m が0であり、 p が0である請求の範囲第1項～第12項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

15 14. R が $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^1$ であり、 R^1 がヒドロキシ、アルキルオキシ、または置換されていてもよいアミノである請求の範囲第1項～第13項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物。

15 15. 請求の範囲第1項～第14項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、その製薬上許容される塩、またはそれらの溶媒和物を含有することを特徴とする医薬組成物。

16. $\text{PGD}_2/\text{TXA}_2$ 両受容体拮抗性である請求の範囲第15項記載の医薬組成物。

17. 喘息治療用である請求の範囲第15項記載の医薬組成物。

25 18. 鼻閉治療用である請求の範囲第15項記載の医薬組成物。

19. アレルギー性結膜炎治療用である請求の範囲第15項記載の医薬組成物。

20. アレルギー性鼻炎治療用である請求の範囲第15項記載の医薬組成物。

21. 喘息、鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎治療用薬剤を製造するための請求の範囲第1項～第14項のいずれかに記載の化合物の使用。

22. 請求の範囲第1項～第14項のいずれかに記載の化合物を投与する鼻閉、アレルギー性結膜炎、またはアレルギー性鼻炎の治療方法。

5 23. 式： $X^3-X^2-X^1-COOH$ （式中、 X^3 はアルキル、アルキルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよいピロリル、アルキル、アルキルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよいインドリル、アルキル、アルキルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよいインドリニルまたはアルキル、アルキルオキシまたはハロゲンで置換されていてもよい1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノ
10 リル、 X^2 は $-SO_2-$ 、 $-S-$ 、または $-CH_2-$ 、 X^1 はチエニルである）で示される化合物またはその塩。

24. 式： $-X^1-X^2-X^3$ で示される基が、5-[(1-ピロリル)スルホニル]-チオフェン-2-イル、5-[(2-メチル-1-ピロリル)スルホニル]-チオフェン-2-イルまたは5-[(2, 5-ジメチル-1-ピロリル)スル
15 ホニル]-チオフェン-2-イルである請求の範囲第23項記載の化合物またはその塩。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/04430

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(See extra sheet.)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
(See extra sheet.)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 97/853 A (Shionogi & Co., Ltd.), 09 January, 1997 (09.01.97), page 1; Claims & EP 837052 A	1-21
A		23, 24

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
25 June, 2001 (25.06.01)Date of mailing of the international search report
10 July, 2001 (10.07.01)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/04430

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 22
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claim 22 pertains to a method for treatment of the human body by therapy.
2. ☒ Claims Nos.: 1-21
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
(See extra sheet.)
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/04430

Continuation of A.

Int.Cl⁷ C07D207/32, C07D207/327, C07D209/08, C07D277/46, C07D277/50, C07D333/40, C07D213/75, C07D405/04, C07D405/12, C07D277/46, C07D333/34, C07D409/06, C07D409/14, C07D333/68, C07D307/68, C07D417/06, C07D413/12, C07D333/76, C07D413/06, C07D513/04, C07D495/04, C07D307/82, C07D495/04, C07D417/12, A61K31/557, A61K31/381, A61K31/4025, A61K31/40, A61K31/404, A61K31/426, A61K31/4402, A61K31/4178, A61K31/429, A61K31/427, A61K31/422, A61K31/4436, A61K31/4725, A61K31/428, A61K31/343, A61K31/538, A61K31/4709, A61K31/4035, A61K31/5415, A61K31/55, A61P43/00, 111, A61P11/06, A61P27/14, A61P37/08, A61P27/16

Continuation of B.

Int.Cl⁷ C07D207/32, C07D207/327, C07D209/08, C07D277/46, C07D277/50, C07D333/40, C07D213/75, C07D405/04, C07D405/12, C07D277/46, C07D333/34, C07D409/06, C07D409/14, C07D333/68, C07D307/68, C07D417/06, C07D413/12, C07D333/76, C07D413/06, C07D513/04, C07D495/04, C07D307/82, C07D495/04, C07D417/12, A61K31/557, A61K31/381, A61K31/4025, A61K31/40, A61K31/404, A61K31/426, A61K31/4402, A61K31/4178, A61K31/429, A61K31/427, A61K31/422, A61K31/4436, A61K31/4725, A61K31/428, A61K31/343, A61K31/538, A61K31/4709, A61K31/4035, A61K31/5415, A61K31/55

Continuation of Box No.I-2 of continuation of first sheet (1)

The term "prodrug" given in the claims is unclear as to what structures are included therein, even after an examination of the description. That term hence makes the scopes of the compound and drug of the invention unclear.

Therefore, claims 1 to 21 and the description do not comply with the given requirements in such a degree that a meaningful international search can be made.

In this international search report, a search was made through prior art documents with respect to compounds specified in the description.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int cl⁷ C07D207/32, C07D207/327, C07D209/08, C07D277/46, C07D277/50, C07D333/40, C07D213/75, C07D405/04, C07D405/12, C07D277/46, C07D333/34, C07D409/06, C07D409/14,

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int cl⁷ C07D207/32, C07D207/327, C07D209/08, C07D277/46, C07D277/50, C07D333/40, C07D213/75, C07D405/04, C07D405/12, C07D277/46, C07D333/34, C07D409/06, C07D409/14,

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO, 97/853, A (塩野義製薬株式会社) 9. 1月. 1997 (09. 01. 97) 第1頁及び請求の範囲 & EP, 837 052, A	1-21
A		23, 24

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

25. 06. 01

国際調査報告の発送日

10.07.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一



4P

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 22 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。つまり、

請求の範囲22の発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

2. ☒ 請求の範囲 1-21 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

別紙参照

3. ☐ 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

A. の続き

C07D333/68, C07D307/68, C07D417/06, C07D413/12, C07D333/76, C07D413/06, C07D513/04, C07D495/04, C07D307/82, C07D495/04, C07D417/12, A61K31/557, A61K31/381, A61K31/4025, A61K31/40, A61K31/404, A61K31/426, A61K31/4402, A61K31/4178, A61K31/429, A61K31/427, A61K31/422, A61K31/4436, A61K31/4725, A61K31/428, A61K31/343, A61K31/538, A61K31/4709, A61K31/4035, A61K31/5415, A61K31/55, A61P43/00 111, A61P11/06, A61P27/14, A61P37/08, A61P27/16

B. の続き

C07D333/68, C07D307/68, C07D417/06, C07D413/12, C07D333/76, C07D413/06, C07D513/04, C07D495/04, C07D307/82, C07D495/04, C07D417/12, A61K31/557, A61K31/381, A61K31/4025, A61K31/40, A61K31/404, A61K31/426, A61K31/4402, A61K31/4178, A61K31/429, A61K31/427, A61K31/422, A61K31/4436, A61K31/4725, A61K31/428, A61K31/343, A61K31/538, A61K31/4709, A61K31/4035, A61K31/5415, A61K31/55

第I欄の2. について

請求の範囲に記載された「プロドラッグ」なる文言は、明細書の記載を検討しても、いかなる構造のものまでを包含するものなのか明確であるとはいえないから、本願発明化合物及び医薬の範囲を不明確にするものである。

したがって、請求の範囲1-21及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

なお、この国際調査報告では、明細書に具体的に記載された化合物に基づいて先行技術文献調査を行った。